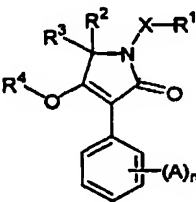




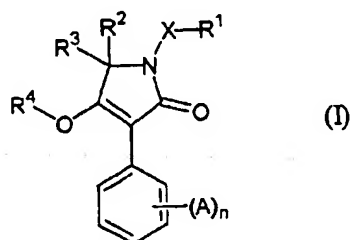
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

|   |  |   |
|---|--|---|
| <p>(51) 国際特許分類7<br/>C07D 207/46, 209/54, 213/30, 307/12,<br/>309/08, 317/34, 401/12, 405/12, 471/10,<br/>491/107, 495/10, A01N 43/36, C07C 259/06</p>   | <p>A1</p>  | <p>(11) 国際公開番号 WO00/68196<br/><br/>(43) 国際公開日 2000年11月16日(16.11.00)</p> |
| <p>(21) 国際出願番号 PCT/JP00/02848<br/>(22) 国際出願日 2000年4月28日(28.04.00)<br/>(30) 優先権データ<br/>特願平11/130499 1999年5月11日(11.05.99) JP<br/>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)<br/>三共株式会社(SANKYO COMPANY, LIMITED)[JP/J]<br/>〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 Tokyo, (JP)<br/>日本化薬株式会社(NIPPON KAYAKU CO., LTD.)(JP/J)<br/>〒102-0071 東京都千代田区富士見1丁目11番2号<br/>東京富士見ビル Tokyo, (JP)<br/>(72) 発明者; および<br/>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ)<br/>三尾 茂(MIO, Shigeru)[JP/J]<br/>伊藤 充(ITO, Mitsuru)[JP/J]<br/>一ノ瀬礼司(ICHINOSE, Reiji)[JP/J]<br/>奥井英史(OKUI, Hideshi)[JP/J]<br/>〒520-2342 滋賀県野洲郡野洲町野洲1041<br/>三共株式会社内 Shiga, (JP)<br/>岩崎俊明(IWASAKI, Toshiaki)[JP/J]<br/>〒330-0835 埼玉県大宮市北袋町2丁目336番地 Saitama, (JP)</p>   | <p>児玉聖一郎(KODAMA, Seiichiro)[JP/J]<br/>〒338-0001 埼玉県与野市上落合6丁目8番22-401 Saitama, (JP)<br/>岩渕 淳(IWABUCHI, Jun)[JP/J]<br/>〒331-0052 埼玉県大宮市三橋5丁目1857-6 Saitama, (JP)<br/>(74) 代理人<br/>中村 稔, 外(NAKAMURA, Minoru et al.)<br/>〒100-8355 東京都千代田区丸の内3丁目3番1号<br/>新東京ビル646号 Tokyo, (JP)<br/><br/>(81) 指定国 AU, BR, CA, CN, CZ, HU, ID, IL, IN, KR, MX,<br/>NO, NZ, PL, RU, TR, US, ZA, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE,<br/>DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE)<br/><br/>添付公開書類<br/>国際調査報告書</p> |   |
| <p>(54) Title: N-SUBSTITUTED DIHYDROPYRROLE DERIVATIVES<br/>(54) 発明の名称 N-置換ジヒドロピロール誘導体</p> <div style="text-align: center;">  <p>(I)</p> </div> <p>(57) Abstract<br/>N-Substituted dihydropyrrole derivatives represented by general formula (I) or salts thereof wherein R<sup>1</sup> is hydrogen, alkyl, or the like; R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are each independently alkyl or the like, or alternatively R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> together with the carbon atom to which they are bonded may form a five- to seven-membered ring or the like; R<sup>4</sup> is hydrogen, alkylcarbonyl, or the like; A is alkyl or the like; n is an integer of 1 to 5; and X is oxygen, sulfur, sulfinyl or sulfonyl.</p> |  |   |

## (57)要約

## 一般式 (I)



[式中、R<sup>1</sup>は、水素原子、アルキル基等、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は、同一又は異なって、アルキル基等、又は、それらが結合している炭素原子と一緒に、5乃至7員環等、R<sup>4</sup>は、水素原子、アルキルカルボニル基等、Aは、アルキル基等、nは、1～5の整数、Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。]で表されるN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

|    |              |     |         |    |                |    |            |
|----|--------------|-----|---------|----|----------------|----|------------|
| AE | アラブ首長国連邦     | DM  | ドミニカ    | KZ | カザフスタン         | RU | ロシア        |
| AG | アンティグア・バーブーダ | DZ  | アルジェリア  | LC | セントルシア         | SD | スーダン       |
| AL | アルバニア        | EE  | エストニア   | LI | リヒテンシュタイン      | SE | スウェーデン     |
| AM | アルメニア        | EES | スペイン    | LK | スリ・ランカ         | SG | シンガポール     |
| AT | オーストリア       | FI  | フィンランド  | LR | リベリア           | SI | スロヴェニア     |
| AU | オーストラリア      | FR  | フランス    | LS | レソト            | SK | スロヴァキア     |
| AZ | アゼルバイジャン     | GA  | ガボン     | LT | リトアニア          | SL | シエラ・レオネ    |
| BA | ボスニア・ヘルツェゴビナ | GB  | 英国      | LU | ルクセンブルグ        | SN | セネガル       |
| BB | バルバドス        | GD  | グレナダ    | LV | ラトヴィア          | SZ | スワジランド     |
| BE | ベルギー         | CE  | グルジア    | MA | モロッコ           | TD | チャード       |
| BG | ブルガリア        | CH  | スイス     | MC | モナコ            | TG | トーゴ        |
| BF | ブルキナ・ファソ     | CM  | カンボジア   | MD | モルドヴァ          | TJ | タジキスタン     |
| BJ | ベナン          | GN  | ギニア     | MG | マダガスカル         | TM | トルクメニスタン   |
| BR | ブラジル         | GR  | ギリシャ    | MK | マケドニア旧ユーゴスラヴィア | TR | トルコ        |
| BY | ベラルーシ        | GW  | ギニア・ビサウ |    | 共和国            | TT | トリニダード・トバゴ |
| CA | カナダ          | HR  | クロアチア   | ML | マリ             | UA | タンザニア      |
| CF | 中央アフリカ       | HU  | ハンガリー   | MN | モンゴル           | TZ | ウクライナ      |
| CG | コンゴ          | ID  | インドネシア  | MR | モリタニア          | UG | ウガンダ       |
| CH | スイス          | IE  | アイルランド  | MW | マラウイ           | US | 米国         |
| CI | コートジボワール     | IL  | イスラエル   | MX | メキシコ           | UZ | ウズベキスタン    |
| CM | カメルーン        | IN  | インド     | MZ | モザンビーク         | VN | ヴェトナム      |
| CN | 中国           | IS  | アイスランド  | NE | ニジェール          | YU | ユーゴスラヴィア   |
| CR | コスタ・リカ       | IT  | イタリア    | NL | オランダ           | ZA | 南アフリカ共和国   |
| CU | キューバ         | JP  | 日本      | NO | ノルウェー          | ZW | ジンバブエ      |
| CY | キプロス         |     | ケニア     | NZ | ニュージーランド       |    |            |
| CZ | チェコ          | KE  | ケニア     | PL | ポーランド          |    |            |
| DE | ドイツ          | KF  | 北朝鮮     | PT | ポルトガル          |    |            |
| DK | デンマーク        | KR  | 韓国      | RO | ルーマニア          |    |            |



## 明細書

## N-置換ジヒドロピロール誘導体

## 〔技術分野〕

本発明は、N-置換ジヒドロピロール誘導体及びその塩、その中間体及び当該N-置換ジヒドロピロール誘導体を有効成分として含有する農薬に関する。

## 〔背景技術〕

従来、3-フェニル-1, 5-ジヒドロピロール-2-オン誘導体は、例えば、特開平4-226957号公報に記載されており公知であるが、ジヒドロピロール環の窒素原子に、直接ヘテロ原子が結合したN-置換-4-ヒドロキシ-1, 5-ジヒドロピロール-2-オン誘導体は全く知られていない。

近年、市販殺虫剤の中には、残留、蓄積、環境汚染等の問題から使用が制限されるものがある。また、同じ殺虫剤を長期間使用することにより、抵抗性害虫の発生が問題となってきた。そのため、市販殺虫剤とは作用が異なると考えられる、新規な分子構造を有する殺虫剤の開発が望まれている。

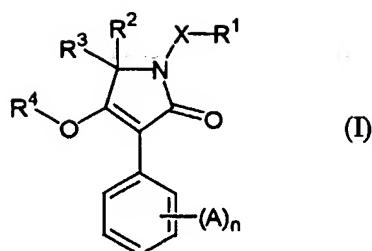
また、除草剤の分野においても、抵抗性雑草の出現という問題があり、市販除草剤とは構造が異なる新しい除草剤の開発が望まれている。

このような農薬として、上記3-フェニル-1, 5-ジヒドロピロール-2-オン誘導体が開発されているが、その農薬としての活性は不十分なものであり、本発明のN-置換ジヒドロピロール-2-オン誘導体は、この欠点を克服するものである。

## 〔発明の開示〕

本発明者らは、ジヒドロピロール誘導体について鋭意研究を重ねた結果、ジヒドロピロール環の窒素原子に、直接酸素原子又は硫黄原子が結合したN-置換ヒドロキシピロール誘導体が、種々の有害昆虫に対し、極めて優れた殺虫活性を有すること、及び、種々の雑草に対し、優れた除草活性を有することを見出し、本発明を完成した。

本発明は、  
下記一般式



[式中、R<sup>1</sup>は、水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基《当該アルキル基は、1個のC<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）、1個のC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルオキシ基、1個の（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ）C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、1乃至3個のハロゲン原子、1個のシアノ基、1個のジ（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。》、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）により置換されてよい。）、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる

群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基(当該フェニルスルホニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)を表し、

$R^2$ 及び $R^3$ は、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。))、1又は2個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1乃至13個のハロゲン原子又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。))により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、フェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)又は5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。))を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環(当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個のジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ基又は1個のN-( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^6$ で表される基(式中、 $R^6$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。))により中断されていてよい。)を表し、

$R^4$ は、水素原子、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基(当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個の $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ基、1

個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、 $C_4\sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基{当該シクロアルキルカルボニル基は、 $C_1\sim C_6$ アルキル基及びハロゲン原子からなる群から選ばれる1乃至4個の置換基、1又は2個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1又は2個のシアノ基又は1個のフェニル基(当該フェニル基は、1個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基により置換されてよい。)}により置換されてよい。)、 $C_3\sim C_7$ アルケニルカルボニル基(当該アルケニルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)、ベンゾイル基{当該ベンゾイル基は、ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)}からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基、1乃至3個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1個の $C_2\sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_2\sim C_7$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基、1個の $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。)、4乃至6員複素環カルボニル基{当該複素環カルボニル基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1乃至3個の $C_1\sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)、1乃至3個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1個の $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基又は1個のハロゲン原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。)、 $C_2\sim C_8$ アルコキシカルボニル基(当該アルコキシカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1個の $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基、1個のフェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。))又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)}により置換されてよい。)、 $C_4\sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基、 $C_3\sim C_7$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_3\sim C_7$ アルキニルオキシカルボニル基、( $C_1\sim C_6$ アルキルチオ)カルボニル基、(フェニルチオ)カルボニル基{当該(フェニルチオ)カルボニル基は、ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置

換されてよい。）、 $(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ})$  チオカルボニル基、 $(\text{フェノキシ})$  チオカルボニル基（当該 $(\text{フェノキシ})$  チオカルボニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_7$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基（当該フェニルジチオカルボニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ})$   $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基（当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又は $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、ジ $(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ $(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又はジ $(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ})$ チオホスホリル基を表し、

Aは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至13個のハロゲン原子により置換されてよい。）、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素

原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基(当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)を表し、

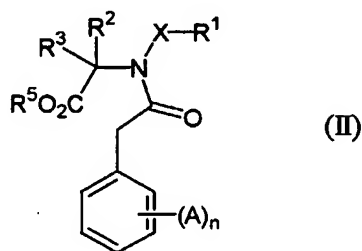
$n$ は、1～5の整数を表し、

$X$ は、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。]

で表されるN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩、

それを有効成分として含有する農薬、

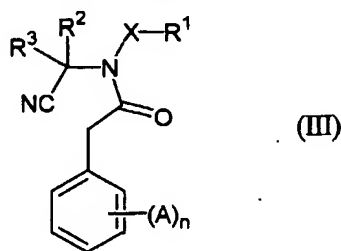
化合物(I)の中間体である下記一般式



[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $A$ 、 $n$ 及び $X$ は、前記と同意義を表し、 $R^5$ は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。]

で表されるN-置換アミド化合物、及び、

化合物(I)の中間体である下記一般式



[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $A$ 、 $n$ 及び $X$ は、前記と同意義を表す。]

で表されるN-置換アミド化合物である。

本発明において、「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」は、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、

2-メチルブチル、1-メチルペンチル、ネオペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル及び1, 1-ジメチルブチルのような、炭素数が1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルキル基であり、好適には炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルキル基 ( $C_1 \sim C_4$ アルキル基) であり、より好適には、炭素数が1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルキル基 ( $C_1 \sim C_3$ アルキル基) であり、更により好適には、炭素数が1又は2個であるアルキル基 ( $C_1 \sim C_2$ アルキル基) であり、特に好適にはメチル基である。

本発明において、「 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル及びシクロヘプチルのような、炭素数が3乃至7個であるシクロアルキル基であり、好適には、炭素数が3乃至6個であるシクロアルキル基 ( $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基) であり、より好適には、炭素数が5又は6個であるシクロアルキル基 ( $C_5 \sim C_6$ シクロアルキル基) であり、更により好適には、シクロヘキシル基である。

本発明において、「ハロゲン原子」は、例えば、塩素原子、フッ素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好適には、塩素原子、フッ素原子又は臭素原子であり、より好適には、塩素原子又はフッ素原子であり、更により好適には、塩素原子である。

本発明において、「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれた1乃至5個の置換基により置換されたフェニル基」は、例えば、クロロフェニル、フルオロフェニル、ブロモフェニル、ヨードフェニル、ジクロロフェニル、ジフルオロフェニル、クロロフルオロフェニル、トリクロロフェニル、トリフルオロフェニル、ペンタフルオロフェニル、メチルフェニル、ジメチルフェニル、トリメチルフェニル、テトラメチルフェニル、エチルフェニル、エチルメチルフェニル、プロピルフェニル、イソプロピルフェニル、ブチルフェニル、tert-ブチルフェニル、ペンチルフェニル、ヘキシルフェニル、メチルクロロフェニル及びメチルフルオロフェニルのような、前記「ハロゲン原子」及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基が置換したフェニル基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」

からなる群から選ばれた同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換したフェニル基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子及び前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」からなる群から選ばれた同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したフェニル基であり、更により好適には、フルオロフェニル基、クロロフェニル基又はメチルフェニル基である。

本発明において、「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」は、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシ、tert-ブトキシ、ペントキシ、イソペントキシ、2-メチルブトキシ、ネオペントキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキシルオキシ、1-メチルペントキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ及び2-エチルブトキシのような、炭素数が1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基であり、好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基）であり、より好適には、炭素数が1乃至3個であるアルコキシ基（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基）であり、更により好適には、炭素数が1又は2個であるアルコキシ基（ $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基）であり、特に好適には、メトキシ基である。

本発明において、「1乃至5個のハロゲン原子により置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」は、例えば、クロロメトキシ、2-クロロエトキシ、3-クロロプロポキシ、4-クロロブトキシ、6-クロロヘキシルオキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエトキシ及びフルオロクロロメトキシのような、同一又は異なった1乃至5個の前記「ハロゲン原子」が置換した前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」であり、好適には、同一若しくは異なった1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」であり、より好適には、同一若しくは異なった1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」であり、更により好適には、3個のフッ素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」であり、更により好適には、トリフルオロメトキシ基又は2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基」は、例えば、ビニルオキシ、



2-プロペニルオキシ、1-メチル-2-プロペニルオキシ、2-メチル-2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ、1-メチル-2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、2-ペンテニルオキシ及び5-ヘキセニルオキシのような、炭素数が2乃至6個の直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基であり、好適には、炭素数が3乃至6個の直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基 ( $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ基) であり、より好適には、炭素数が3乃至5個の直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基 ( $C_3 \sim C_5$ アルケニルオキシ基) であり、更により好適には、炭素数が3又は4個の直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基 ( $C_3 \sim C_4$ アルケニルオキシ基) であり、特に好適には、アリルオキシ基である。

本発明において、「( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」は、例えば、メトキシメトキシ、メトキシエトキシ、メトキシプロポキシ、メトキシブトキシ、メトキシペンチルオキシ、メトキシヘキシルオキシ、エトキシメトキシ、エトキシエトキシ、エトキシプロポキシ、イソプロポキシメトキシ、イソプロポキシエトキシ、tert-ブトキシメトキシ、tert-ブトキシエトキシ及びヘキシルオキシヘキシルオキシのような、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」であり、好適には、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」{ ( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基} であり、より好適には前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」が置換した「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」{ ( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基} であり、より好適には、前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」であり、更により好適には、メトキシメトキシ基、エトキシメトキシ基、2-メトキシエトキシ基又は2-エトキシエトキシ基である。

本発明において、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基」は、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、2-メチルブチルチオ、1-メチルペンチルチオ、ネオペンチルチオ、ヘキシルチオ、1-メチルヘキシルチオ、3, 3-ジメチルブチルチオ及び2, 2-ジメチルブチルチオのような、炭素数が1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基であり、好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基 ( $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基) であり、より好

適には、炭素数が1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基 ( $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基) であり、更により好適には、炭素数が1又は2個であるアルキルチオ基 ( $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基) であり、特に好適には、メチルチオ基である。

本発明において、「ジ ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基」は、例えば、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基及びジヘキシルアミノ基のような、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」が2個結合したアミノ基であり、好適には、前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」が2個結合したアミノ基 {ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノ基} であり、より好適には、前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」が2個結合したアミノ基であり、更により好適には、前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」が2個結合したアミノ基であり、特に好適には、ジメチルアミノ基である。

本発明において、「5若しくは6員複素環基 (当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。)」は、例えば、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、テトラヒドロフラニル、1, 3-ジオキサニル、テトラヒドロピラニル、ピラゾリニル、ピペラジニル、1, 4-ジオキサニル、ピロリジル、ピペリジル及びモルホルルのような、環に1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基であり、好適には、環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基であり、より好適には、環に1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基であり、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ のアルキル基の置換基として、更により好適には、ピリジル基、チエニル基、テトラヒドロフラニル基又はジオキサニル基であり、特に好適には、ピリジル基、チエニル基又はジオキサニル基であり、最も好適には、ジオキサニル基であり、 $R^4$ 又はAとして、更により好適には、ピリジル基、チエニル基、テトラヒドロフラニル基又はジオキサニル基であり、特に好適には、ピリジル基、チエニル基又はジオキサニル基であり、最も好適には、ピリジル基又はチエニル基であり、 $R^4$ に含まれるものとして、更により好適には、1個の酸素

原子若しくは窒素原子を含有する5若しくは6員複素環基であり、特に好適には、ピリジル基、チエニル基又はテトラヒドロフラニル基であり、最も好適には、テトラヒドロフラニル基である。

本発明において、「1乃至3個のハロゲン原子により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基」は、例えば、クロロメチル、ブロモメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチル、ヨードメチル、クロロエチル、トリフルオロエチル、クロロプロピル、クロロブチル、クロロペンチル及びクロロヘキシルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「ハロゲン原子」が置換した前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」であり、より好適には、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」である。

本発明において、「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれた1又は2個の置換基により置換された5若しくは6員複素環基」は、例えば、クロロピリジル、クロロチエニル、クロロテトラヒドロフラニル、クロロジオキソラニル、ジクロロピリジル、ジクロロチエニル、ジクロロジオキソラニル、フルオロピリジル、フルオロチエニル、フルオロジオキソラニル、ジフルオロピリジル、ジフルオロオキソラニル、ブロモピリジル、ブロモチエニル、ブロモジオキソラニル、ジブロモピリジル、ヨードピリジル、メチルピリジル、ジメチルピリジル、エチルピリジル、プロピルピリジル、イソプロピルピリジル、ブチルピリジル、tert-ブチルピリジル、ペンチルピリジル、ヘキシルピリジル、メチルチエニル、エチルチエニル、ジメチルチエニル、メチルジオキソラニル、ジメチルジオキソラニル、クロロメチルピリジル及びトリフルオロメチルピリジルのような、前記「ハロゲン原子」、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」及び前記「1乃至3個のハロゲン原子により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基」からなる群から選ばれた同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した前記「5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）」であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」及び「1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換された $C_1 \sim C_4$ アルキル基」からなる群から選

ばれた同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した「環に1乃至3個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子、前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」及び「1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換された $C_1 \sim C_3$ アルキル基」からなる群から選ばれた同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した「環に1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」であり、更により好適には、塩素原子、フッ素原子、メチル基及びエチル基からなる群から選ばれた同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したピリジル基、チエニル基又はジオキソラニル基である。

本発明の $R^1$ において、「1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。)、1個の $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基、1個の( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、1乃至3個のハロゲン原子、1個のシアノ基、1個のジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。))により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基」は、例えば、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルブチル、ベンジル、(4-クロロフェニル)メチル、(4-メチルフェニル)メチル、フェニルブチル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、ブトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、ブトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシエチル、メトキシブチル、 $\alpha$ 、 $\alpha$ -ジメトキシメチル、 $\alpha$ 、 $\alpha$ -ジエトキシメチル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシメチル、 $\alpha$ 、 $\alpha$ 、 $\alpha$ -トリフルオロメチル、アリルオキシメチル、2-ブテニルオキシメチル、メトキシエトキシメチル、エトキシエトキシメチル、ベンジルオキシメチル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、クロロメチル、2-クロロエチル、シアノメチル、1-シアノエチル、4-シアノブチル、ジメチルアミノメチル、2-ピリジルメチル、3-ピリ

ジルメチル、2-チエニルメチル、1-ピラゾリルメチル、1-イミダゾリルメチル、2-テトラヒドロフラニルメチル及び2-ジオキソラニルメチルのような、1個の前記「 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基」、1個のフェニル基、1個の前記「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれた1乃至5個の置換基により置換されたフェニル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、同一又は異なった1又は2個の前記「1乃至5個のハロゲン原子により置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1個のベンジルオキシ基、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基」、同一又は異なった1乃至3個の前記「ハロゲン原子」、1個のシアノ基、1個の前記「ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基」、1個の前記「5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。)」又は1個の前記「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換された5若しくは6員複素環基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、1個の前記「 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基」、1個のフェニル基、1個の「塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれた同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換したフェニル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、同一又は異なった1又は2個の「塩素原子、フッ素原子及び臭素原子からなる群から選ばれた同一又は異なった1乃至5個の置換基により置換された $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_3 \sim C_5$ アルケニルオキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、1個のベンジルオキシ基、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基」、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個のシアノ基、1個の前記「ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノ基」、1個の「5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。)」又は1個の「塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれた同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した、環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」であり、より好適には、1個の前記「 $C_3 \sim C_6$ シクロ

アルキル基」、1個のフェニル基、1個の「塩素原子、フッ素原子及び $C_1 \sim C_3$ アルキル基からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したフェニル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、同一又は異なった1又は2個の「同一又は異なった1又は3個の塩素原子又はフッ素原子により置換された $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_3 \sim C_4$ アルケニルオキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、1個のベンジルオキシ基、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基」、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のシアノ基、1個の前記「ジ( $C_1 \sim C_3$ アルキル) アミノ基」、1個の「5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)」又は1個の「塩素原子、フッ素原子及び $C_1 \sim C_3$ アルキル基からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した、環に1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」は、例えば、ビニル、2-クロロビニル、2-プロペニル、2-クロロ-2-プロペニル、3-クロロ-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、1-ヘキセニル及び5-ヘキセニルのような、炭素数が2乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基であり、好適には、炭素数が3乃至5個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基( $C_3 \sim C_5$ アルケニル基)であり、好適には、炭素数が3又は4個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基( $C_3 \sim C_4$ アルケニル基)であり、より好適には、2-プロペニル基である。

本発明において、「1乃至3個のハロゲン原子により置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」は、例えば、3-クロロ-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニル、5,5-ジクロロ-4-ペンテニル及び4,5,5-トリフルオロ-4-ペンテニルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記

「ハロゲン原子」が置換した前記「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基」であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子が置換した前記「 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基」であり、より好適には、同一又は異なった1又は2個の塩素原子又はフッ素原子が置換した前記「 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基」であり、更により好適には、1又は2個の塩素原子が置換したプロペニル基である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基」は、例えば、エチニル、2-プロピニル、1-メチルプロピニル、2-ブチニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル及び5-ヘキシニルのような、炭素数が2乃至6個の直鎖又は分岐鎖アルキニル基であり、好適には、炭素数が3乃至5個の直鎖又は分岐鎖アルキニル基（ $C_3 \sim C_5$ アルキニル基）であり、より好適には、炭素数が3又は4個の直鎖又は分岐鎖アルキニル基（ $C_3 \sim C_4$ アルキニル基）であり、更により好適には、2-プロピニル基である。

本発明において、「1個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）により置換された5若しくは6員複素環基」は、例えば、5-メチル-2-フラニル、5-メチル-2-チエニル、4-メチル-2-オキサゾリル、5-メチル-2-チアゾリル、3-メチル-5-イソオキサゾリル、6-メチル-2-ピリジル、6-メチル-3-ピリジル、6-トリフルオロメチル-3-ピリジル、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル、5-メチル-2-ピリミジニル、5-メチル-2-ピラジニル、5-メチル-2-ピリダジニル、4-メチル-2-テトラヒドロフラニル及び5-メチル-2-テトラヒドロピラニルのような、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」又は1個の前記「1乃至3個のハロゲン原子により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基」が置換した前記「5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子若しくは窒素原子を含有する。）」であり、好適には、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」又は1個の「1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換された $C_1 \sim C_4$ アルキル基」が置換した「環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」であり、より好適には、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」又は1個の「1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換された $C_1 \sim C_3$ アルキル基」が置換した「環に1乃至2個の酸素原

子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」であり、更により好適には、トリフルオロメチルピリジル基又はチエニル基である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基」は、例えば、アセチル、プロピオニル、プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、ブチルカルボニル、*sec*-ブチルカルボニル、イソブチルカルボニル、*tert*-ブチルカルボニル、ペンチルカルボニル、ペンチル-2-カルボニル、2, 2-ジメチル-1-プロピルカルボニル、ヘキシルカルボニル、ヘプチルカルボニル、オクチルカルボニル及びノニルカルボニルのような、炭素数が1乃至9個である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニル基であり、好適には、炭素数が1乃至7個である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニル基 ( $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基) であり、より好適には、炭素数が1乃至5個である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニル基 ( $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基) であり、更により好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニル基 ( $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニル基) であり、特に好適には、2, 2-ジメチルプロピオニル基、2, 2-ジメチルブチリル基、3, 3-ジメチルブチリル基又はアセチル基である。

本発明の $R^1$ において、「1乃至3個のハロゲン原子、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基」は、例えば、メトキシアセチル、エトキシアセチル、イソプロポキシアセチル、フェノキシアセチル、3-フェノキシプロピオニル、クロロアセチル、トリクロロアセチル、トリフルオロアセチル、3-クロロプロピオニル、2, 2-ジメチル-3-クロロプロピオニル、2-クロロ-2-メチルプロピオニル及び2-メトキシノニルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「ハロゲン原子」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」又は1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基」であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」又は1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基」であり、より好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」又は1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_2 \sim C_6$ アル



キルカルボニル基」であり、更により好適には、1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニル基」である。

本発明において、「1乃至5個のハロゲン原子又は1個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基により置換されたベンゾイル基」は、例えば、クロロベンゾイル、ジクロロベンゾイル、トリクロロベンゾイル、フルオロベンゾイル、ジフルオロベンゾイル、トリフルオロベンゾイル、ペンタフルオロベンゾイル、プロモベンゾイル、ヨードベンゾイル、クロロフルオロベンゾイル、メチルベンゾイル、エチルベンゾイル、プロピルベンゾイル、イソプロピルベンゾイル、ブチルベンゾイル、tert-ブチルベンゾイル、ペンチルベンゾイル及びヘキシルベンゾイルのような、同一又は異なった1乃至5個の前記「ハロゲン原子」又は1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」が結合したベンゾイル基であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」が結合したベンゾイル基であり、より好適には、1又は2個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」が結合したベンゾイル基であり、更により好適には、クロロベンゾイル基又はメチルベンゾイル基である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基」は、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、シクロブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ペントキシカルボニル、ペンチル-2-オキシカルボニル、2,2-ジメチルペンチル-1-オキシカルボニル、ペンチル-3-オキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、1,2-ジメチルプロポキシカルボニル、1,2,2-トリメチルプロポキシカルボニル及び1-イソプロピル-2-メチルプロポキシカルボニルのような、炭素数が1乃至7個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が結合したカルボニル基（ $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基）であり、好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が結合したカルボニル基（ $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基）であり、より好適には、炭素数が1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が結合したカルボニル基（ $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基）であり、更により好適には、炭素数が1又は2個であるアルコキシ基が結合したカルボニル基（ $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基）であり、特に好適

には、メトキシカルボニル基である。

本発明において、「ジ ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) カルバモイル基」は、例えば、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ジプロピルアミノカルボニル基、ジイソプロピルアミノカルボニル基、ジブチルアミノカルボニル基及びジヘキシルアミノカルボニル基のような、同一又は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル」が窒素原子に結合したカルバモイル基であり、好適には、同一又は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル」が窒素原子に結合したカルバモイル基 {ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基} であり、より好適には、同一又は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル」が窒素原子に結合したカルバモイル基 {ジ ( $C_1 \sim C_3$ アルキル) カルバモイル基} であり、更により好適には、同一又は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル」が窒素原子に結合したカルバモイル基 {ジ ( $C_1 \sim C_2$ アルキル) カルバモイル基} であり、特に好適には、ジメチルカルバモイル基である。

本発明において、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基」は、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、イソプロピルスルホニル、プロピルスルホニル、ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル及びヘキシルスルホニルのような、炭素数が1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルホニル基であり、好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルホニル基 ( $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基) であり、より好適には、炭素数が1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルホニル基 ( $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基) であり、更により好適には、炭素数が1又は2個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルホニル基 ( $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニル基) であり、特に好適には、メチルスルホニル基である。

本発明において、「1乃至5個のハロゲン原子又は1個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基により置換されたフェニルスルホニル基」は、例えば、クロロフェニルスルホニル、ジクロロフェニルスルホニル、トリクロロフェニルスルホニル、フルオロフェニルスルホニル、ジフルオロフェニルスルホニル、トリフルオロフェニルスルホニル、ペンタフルオロフェニルスルホニル、プロモフェニルスルホニル、ヨードフェニルスルホニル、クロロフルオロフェニルスルホニル、メチルフェニルスルホニル、エチルフェニルスルホニル、プロピルフェニルスルホニル、イソプロピルフェニルスルホニル、ブチルフェニルスルホニル、tert-ブチルフェニルスルホニル、ペンチ

ルフェニルスルホニル及びヘキシルフェニルスルホニルのような、同一又は異なった1乃至5個の前記「ハロゲン原子」又は1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」が置換したフェニルスルホニル基であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」が置換したフェニルスルホニル基であり、より好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」が置換したフェニルスルホニル基であり、更により好適には、同一又は異なった1又は2個の塩素原子若しくはフッ素原子又は前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」が置換したフェニルスルホニル基である。

本発明の $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ において、「ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されたフェニル基」は、例えば、クロロフェニル、フルオロフェニル、ブロモフェニル、ヨードフェニル、ジクロロフェニル、ジフルオロフェニル、クロロフルオロフェニル、トリクロロフェニル、トリフルオロフェニル、パーフルオロフェニル、メチルフェニル、ジメチルフェニル、トリメチルフェニル、テトラメチルフェニル、エチルフェニル、エチルメチルフェニル、プロピルフェニル、イソプロピルフェニル、ブチルフェニル、tert-ブチルフェニル、ペンチルフェニル、ヘキシルフェニル、メチルクロロフェニル、メチルフルオロフェニル、メトキシフェニル、ジメトキシフェニル、エトキシフェニル、プロポキシフェニル、ヘキルオキシフェニル及びメトキシメチルフェニルのような、前記「ハロゲン原子」、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基が置換したフェニル基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」及び前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換したフェニル基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子、前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」及び前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したフェニル基であり、更により好適には、塩素原子、フッ素原子、メチル基及びメトキシ基からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したフェニル基である。

本発明の $R^2$ 及び $R^3$ において、「1個の $C_3\sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基及び $C_1\sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1個の（ $C_1\sim C_6$ アルコキシ） $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1乃至13個のハロゲン原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）により置換された $C_1\sim C_6$ アルキル基」は、例えば、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロヘキシルメチル、ベンジル、1-フェニルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルエチル、4-フェニルブチル、クロロベンジル、プロモベンジル、フルオロベンジル、ジクロロベンジル、ジフルオロベンジル、パークロロベンジル、メチルベンジル、ジメチルベンジル、トリメチルベンジル、テトラメチルベンジル、メトキシベンジル、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、ジメトキシエチル、ヘキシルオキシメチル、メトキシメトキシメチル、メトキシメトキシエチル、メトキシエトキシメチル、メトキシエトキシエチル、エトキシメトキシメチル、エトキシメトキシエチル、エトキシエトキシメチル、エトキシエトキシエチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、パーフルオロヘキシル、1, 3-ジオキサソ-2-イルメチル、1, 3-ジオキサソ-2-イルエチル、テトラヒドロフラニルメチルのような、1個の前記「 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル基」、1個のフェニル基、1個の前記「ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基及び $C_1\sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されたフェニル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「（ $C_1\sim C_6$ アルコキシ） $C_1\sim C_6$ アルコキシ基」、同一又は異なった1乃至13個の前記「ハロゲン原子」又は1個の前記「5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）」により置換された前記「 $C_1\sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、1個の前記「 $C_3\sim C_7$ シクロアルキル基」、1個のフェニル基、1個の「塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル基及び $C_1\sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基により置換されたフェニル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1\sim C_4$ アルコキシ基」、1個の前記「（ $C_1$

～C<sub>4</sub>アルコキシ) C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ基」、同一又は異なった1乃至5個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の「環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」により置換された前記「C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基」であり、より好適には、1個の前記「C<sub>3</sub>～C<sub>3</sub>シクロアルキル基」、1個のフェニル基、1個の「塩素原子、フッ素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基及びC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基により置換されたフェニル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基」、1個の前記「(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ) C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基」、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個の「環に1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」により置換された前記「C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基」であり、更により好適には、シクロヘキシルメチル、ベンジル、クロロベンジル、メチルベンジル、メトキシベンジル、メトキシエチル、メトキシエトキシエチル又はトリフルオロメチル基である。

本発明において、「モノ (C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基」は、例えば、モノメチルアミノ基、モノエチルアミノ基、モノプロピルアミノ基、モノイソプロピルアミノ基、モノブチルアミノ基及びモノヘキシルアミノ基のような、前記「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基」が1個結合したアミノ基であり、好適には、前記「C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基」が1個結合したアミノ基 (モノ (C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル) アミノ基) であり、より好適には、前記「C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基」が1個結合したアミノ基であり、更により好適には、前記「C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキル基」が1個結合したアミノ基であり、特に好適には、モノメチルアミノ基である。

本発明において、「4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環 {当該環は、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式N R<sup>6</sup>で表される基 (式中、R<sup>6</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基を表す。) により中断されていてよい。} 」とは、例えば、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、N-メチルピペラジン、シクロヘキセン、シクロペンテン、オキソラン、1, 3-ジオキソラン、1, 3-ジチオラン及び5, 6-ジヒドロ-4H-[1, 3]

オキサジン環のような、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環であって、環上の任意の炭素原子が、酸素原子、硫黄原子又は式 $\text{NR}^6$ で表される基であってもよい環であり、好適には、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環{当該環は、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $\text{NR}^6$ で表される基(式中、 $\text{R}^6$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基を表す。)により中断されていてよい。}であり、より好適には、4乃至6員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環{当該環は、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $\text{NR}^6$ で表される基(式中、 $\text{R}^6$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基を表す。)により中断されていてよい。}であり、更に、より好適には、シクロヘキサン環である。

本発明において、「 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキレンジオキシ基」は、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ又はテトラメチレンジオキシ基のような、炭素数が1乃至4個である直鎖のアルキレンジオキシ基であり、好適には、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基又はトリメチレンジオキシ基であり、より好適には、エチレンジオキシ基又はトリメチレンジオキシ基である。

本発明において、「 $\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルコキシ})$  イミノ基」は、例えば、 $\text{N}$ -メトキシイミノ、 $\text{N}$ -エトキシイミノ、 $\text{N}$ -プロポキシイミノ、 $\text{N}$ -イソプロポキシイミノ、 $\text{N}$ -ブトキシイミノ、 $\text{N}$ -ペンチルオキシイミノ又は $\text{N}$ -ヘキシルオキシイミノ基のような、前記「 $\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルコキシ基}$ 」が窒素原子に結合したイミノ基であり、好適には、前記「 $\text{C}_1\sim\text{C}_4\text{アルコキシ基}$ 」が窒素原子に結合したイミノ基{ $\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_4\text{アルコキシ})$  イミノ基}であり、より好適には、前記「 $\text{C}_1\sim\text{C}_3\text{アルコキシ基}$ 」が窒素原子に結合したイミノ基{ $\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_3\text{アルコキシ})$  イミノ基}であり、更に、より好適には、前記「 $\text{C}_1\sim\text{C}_2\text{アルコキシ基}$ 」が窒素原子に結合したイミノ基{ $\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_2\text{アルコキシ})$  イミノ基}である。

本発明の $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ において、「1乃至3個の $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル基、1個の $\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルコキシ基}$ 、1個の $(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルコキシ})\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルコキシ基}$ 、1個の $(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルキル})$  アミノ基、1個の $\text{C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキレンジオキシ基}$ 又は1個の $\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルコキシ})$  イミノ基により置換された4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環」は、例えば、3-メチル

シクロペンタン、3-メトキシシクロペンタン、3, 4-ジメチルシクロペンタン、2-メチルシクロヘキサン、3-メチルシクロヘキサン、4-メチルシクロヘキサン、3, 5-ジメチルシクロヘキサン、4-エチルシクロヘキサン、4-プロピルシクロヘキサン、4-ブチルシクロヘキサン、4-メトキシシクロヘキサン、4-エトキシシクロヘキサン、4-メトキシメトキシシクロヘキサン、4-エトキシメトキシシクロヘキサン、4-メトキシエトキシシクロヘキサン、4-エトキシエトキシシクロヘキサン、4-ジメチルアミノシクロヘキサン、4, 4-エチレンジオキシシクロヘキサン、4, 4-トリメチレンジオキシシクロヘキサン、4-(N-メトキシイミノ)シクロヘキサン、4-(N-エトキシイミノ)シクロヘキサン、4-メチル-3-シクロヘキセン、4-メチル-2-シクロヘキセン、3, 4-ジメチル-2-シクロペンテン、2-メチルテトラヒドロピラン、2, 6-ジメチルテトラヒドロピラン、1, 2-ジメチルピペラジン、2-メチル-1, 3-ジオキサラン及び2-メチルテトラヒドロフランのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基」1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ基」又は1個の前記「N-( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) イミノ基」により置換された前記「4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環〔当該環は、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^6$ で表される基（式中、 $R^6$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。〕」であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」又は1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、前記「( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、前記「ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノ基」、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基若しくは前記「N-( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ) イミノ基」により置換された4乃至7員飽和環であり、より好適には、1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」又は1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、前記「( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、前記「ジ( $C_1 \sim C_3$ アルキル) アミノ基」、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基若しくは前記「N-( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) イミノ基」により置換された4乃至6員飽和環であり、更により好適には、

1 又は 2 個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」又は 1 個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」、前記「( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基若しくは前記「N-( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ) イミノ基」により置換されたシクロヘキサン環であり、特に好適には、1 個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基又は前記「N-( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ) イミノ基」により置換されたシクロヘキサン環であり、最も好適には、メトキシシクロヘキサン環である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ基」は、例えば、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、プロピルカルボニルオキシ、イソプロピルカルボニルオキシ、ブチルカルボニルオキシ、sec-ブチルカルボニルオキシ、イソブチルカルボニルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ペンチルカルボニルオキシ、ペンチル-2-カルボニルオキシ、2, 2-ジメチル-1-プロピルカルボニルオキシ及びヘキシルカルボニルオキシのような、炭素数が 1 乃至 6 個である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニルオキシ基であり、好適には、炭素数が 1 乃至 4 個である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニルオキシ基( $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基)であり、より好適には、炭素数が 1 乃至 3 である直鎖又は分岐鎖のアルキル基が結合したカルボニルオキシ基( $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基)であり、更により好適には、アセチルオキシ基である。

本発明の  $R^4$  において、「1 乃至 3 個のハロゲン原子、1 個の  $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ基、1 個の  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は 1 個のフェノキシ基により置換された  $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基」は、例えば、クロロプロピオニル、メチルクロロプロピオニル、ジメチルクロロプロピオニル、ジメチルアセトキシプロピオニル、メトキシアセチル、エトキシアセチル、メチルメトキシプロピオニル、メチルエトキシプロピオニル、メチルメトキシブタノイル及びフェノキシアセチルのような、同一又は異なった 1 乃至 3 個の前記「ハロゲン原子」、1 個の前記「 $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ基」、1 個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」又は 1 個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基」であり、好適には、同一又は異なった 1 乃至 3 個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1 個の前記「 $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基」、1 個の前記「 $C_1$



～C<sub>4</sub>アルコキシ基」又は1個のフェノキシ基が置換した前記「C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキルカルボニル基」であり、より好適には、同一又は異なった1又は2個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の前記「C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニルオキシ基」、1個の前記「C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基」又は1個のフェノキシ基が置換した前記「C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基」であり、更により好適には、1個の塩素原子、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、メトキシ基又はエトキシ基が置換した前記「C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル基」である。

本発明において、「C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルカルボニル基」は、例えば、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニルのような、炭素数が3乃至6個であるシクロアルキル基が結合したカルボニル基であり、好適には、シクロプロピルカルボニル基である。

R<sup>4</sup>のシクロアルキルカルボニル基の置換基において、「1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基により置換されたフェニル基」は、例えば、メトキシフェニル、エトキシフェニル、プロポキシフェニル、イソプロポキシフェニル、ブトキシフェニル、ペンチルオキシフェニル及びヘキシルオキシフェニルのような、1個の前記「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基」が結合したフェニル基であり、好適には、1個の前記「C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ基」が結合したフェニル基であり、より好適には、1個の前記「C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基」が結合したフェニル基であり、更により好適には、エトキシフェニル基である。

本発明のR<sup>4</sup>において、「C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基及びハロゲン原子からなる群から選ばれる1乃至4個の置換基、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1又は2個のシアノ基又は1個のフェニル基（当該フェニル基は、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基により置換されてよい。）により置換されたC<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルカルボニル基」は、例えば、メチルシクロプロパンカルボニル、ジメチルシクロプロパンカルボニル、トリメチルシクロプロパンカルボニル、テトラメチルシクロプロパンカルボニル、メチルジクロロシクロプロパンカルボニル、シアノシクロプロパンカルボニル、フェニルシクロプロパンカルボニル、（エトキシフェニル）シクロプロパンカルボニル、（エトキシフェニル）ジクロロシクロプロパンカルボニル、メチルシクロ

ペンタンカルボニル、メトキシシクロペンタンカルボニル、メチルシクロヘキサンカルボニル及びメトキシシクロヘキサンカルボニルのような、前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」及び前記「ハロゲン原子」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至4個の置換基、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1又は2個のシアノ基、1個のフェニル基又は1個の前記「1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基により置換されたフェニル基」が置換した前記「 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基」であり、好適には、前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」、塩素原子、フッ素原子及び臭素原子からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至4個の置換基、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、1又は2個のシアノ基、1個のフェニル基又は1個の前記「1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基により置換されたフェニル基」が置換した前記「 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基」であり、より好適には、前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」、塩素原子及びフッ素原子からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至4個の置換基、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、1個のシアノ基、1個のフェニル基又は1個の前記「1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基により置換されたフェニル基」が置換した前記「 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基」であり、更により好適には、1個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」が置換したシクロプロピルカルボニル基であり、特に好適には、1個のメチル基が置換したシクロプロピルカルボニル基である。

本発明において、「 $C_3 \sim C_7$ アルケニルカルボニル基」は、例えば、アクリロイル、2-ブテノイル、メチルアクリロイル、3-ブテノイル、2-ペンテノイル、4-ペンテノイル、2-メチル-2-ブテノイル、3-メチル-2-ブテノイル、1-シクロヘキセンカルボニル、1-シクロペンテンカルボニル、2-ヘキセノイル、5-ヘキセノイル、1-ヘプテノイル及び6-ヘプテノイルのような、炭素数が2乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基が結合したカルボニル基であり、好適には、炭素数が2乃至5個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基が結合したカルボニル基（ $C_3 \sim C_6$ アルケニルカルボニル基）であり、より好適には、炭素数が2乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基が結合したカルボニル基（ $C_3 \sim C_5$ アルケニルカルボニル基）であり、好適には、炭素数が2又は3個である直鎖又は分岐鎖アルケニル基が結合したカルボニル基（ $C_3 \sim C_4$ アルケニルカルボニル基）で

あり、より好適には、アリルカルボニル基である。

本発明において、「1乃至3個のハロゲン原子により置換された $C_3\sim C_7$ アルケニルカルボニル基」は、例えば、クロロアクリロイル、ジクロロアクリロイル、トリクロロアクリロイル、ブromoアクリロイル、フルオロアクリロイル、ジクロロペンテノイル、ジクロロヘキセノイルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「ハロゲン原子」が置換した前記「 $C_3\sim C_7$ アルケニルカルボニル基」であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子が置換した前記「 $C_3\sim C_6$ アルケニルカルボニル基」であり、より好適には、同一又は異なった1又は2個の塩素原子又はフッ素原子が置換した前記「 $C_3\sim C_5$ アルケニルカルボニル基」であり、更により好適には、1又は2個の塩素原子が置換した $C_3\sim C_4$ アルケニルカルボニル基である。

本発明の $R^4$ のベンゾイル基の置換基において、「1乃至3個のハロゲン原子又は1個のフェノキシ基により置換された $C_1\sim C_6$ アルキル基」は、例えば、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロエチル、フェノキシメチル、フェノキシエチル、フェノキシプロピル、フェノキシブチル、フェノキシペンチル及びフェノキシヘキシルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「ハロゲン原子」又は1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_1\sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_1\sim C_4$ アルキル基」であり、より好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個のフェノキシ基が置換した前記「 $C_1\sim C_3$ アルキル基」であり、更により好適には、トリフルオロメチル又はフェノキシメチル基である。

本発明において、「 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル基」は、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、ブチルスルフィニル、tert-ブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル及びヘキシルスルフィニルのような、炭素数が1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルフィニル基であり、好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルフィニル基（ $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル基）であり、より好適には、

炭素数が1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルキルスルフィニル基 ( $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル基) であり、更により好適には、メチルスルフィニル基である。

本発明の  $R^1$  において、「ハロゲン原子及び  $C_1 \sim C_6$  アルキル基 (当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。) からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基、1乃至3個の  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基、1個の  $C_2 \sim C_7$  アルキルカルボニルオキシ基、1個の  $C_2 \sim C_7$  アルコキシカルボニル基、1個の  $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ基、1個の  $C_1 \sim C_6$  アルキルスルフィニル基、1個の  $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されたベンゾイル基」は、例えば、クロロベンゾイル、ジクロロベンゾイル、トリクロロベンゾイル、メチルベンゾイル、ジメチルベンゾイル、トリメチルベンゾイル、メトキシベンゾイル、ジメトキシベンゾイル、トリメトキシベンゾイル、メチル-メトキシベンゾイル、メチル-クロロベンゾイル、トリフルオロメチルベンゾイル、フェノキシメチルベンゾイル、アセトキシベンゾイル、メトキシカルボニルベンゾイル、メチルチオベンゾイル、メチルスルフィニルベンゾイル、メチルスルホニルベンゾイル、フェノキシベンゾイル、シアノベンゾイル及びニトロベンゾイルのような、前記「ハロゲン原子」、前記「 $C_1 \sim C_6$  アルキル基」及び前記「1乃至3個のハロゲン原子又は1個のフェノキシ基により置換された  $C_1 \sim C_6$  アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基、同一又は異なった1乃至3個の前記「 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_7$  アルキルカルボニルオキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_7$  アルコキシカルボニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルフィニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル基」、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基が置換したベンゾイル基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、前記「 $C_1 \sim C_4$  アルキル基」及び「同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個のフェノキシ基により置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基、同一又は異なった1乃至3個の前記「 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_6$  アルキルカルボニルオキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_5$  アルコキシカルボニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$  アルキルチオ

基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基」、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基が置換したベンゾイル基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子、前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」及び「同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個のフェノキシ基により置換された $C_1 \sim C_3$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基」、1個の前記「 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基」、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基が置換したベンゾイル基であり、更により好適には、クロロベンゾイル、フルオロベンゾイル、ジフルオロベンゾイル、メチルベンゾイル、メトキシベンゾイル、メチルメトキシベンゾイル、トリフルオロメチルベンゾイル、フェノキシメチルベンゾイル、メトキシベンゾイル、ジメトキシベンゾイル、トリメトキシベンゾイル、エトキシベンゾイル、プロポキシベンゾイル、アセトキシベンゾイル、メトキシカルボニルベンゾイル、メチルチオベンゾイル、メチルスルフィニルベンゾイル、メチルスルホニルベンゾイル、フェノキシベンゾイル、シアノベンゾイル又はニトロベンゾイル基である。

本発明において、「4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ベンゼン環と結合してもよい。）」は、例えば、クロマンカルボニル、ベンゾジオキサールカルボニル、ピリジンカルボニル、ピリミジンカルボニル、ピラジンカルボニル、ピリダジンカルボニル、ピラゾールカルボニル、チアゾールカルボニル、オキサゾールカルボニル、イソオキサゾールカルボニル、チアジアゾールカルボニル、オキセタンカルボニル、N-モルホリンカルボニル、テトラヒドロフランカルボニル及びテトラヒドロピランカルボニルのような、環中に、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ベンゼン環と縮合してもよい、4乃至6員の飽和又は不飽和複素環が結合したカルボニル基であり、好適には、環中に、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ベンゼン環と縮合してもよい、4乃至6員の飽和又は不飽和

複素環が結合したカルボニル基であり、より好適には、ベンゾジオキソールカルボニル、ピリジンカルボニル、N-モルフォリンカルボニル、オキセタンカルボニル、ピラゾールカルボニル、チアジアゾールカルボニル、ピリミジンカルボニル又はクロマンカルボニル基である。

本発明において、「1乃至3個の $C_1\sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、1乃至3個の $C_1\sim C_6$ アルコキシ基、1個の $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基又は1個のハロゲン原子により置換された4乃至6員複素環カルボニル基」は、例えば、メチルピリジンカルボニル、メチルピリミジンカルボニル、トリフルオロメチルピリジンカルボニル、メチルーチオメチルピリミジンカルボニル、チオメチルートリフルオロメチルピリミジンカルボニル、ジメチルピラゾールカルボニル、メチルートリフルオロメチルピラゾールカルボニル、メチルチアゾールカルボニル、メチルチアジアゾールカルボニル、メチルオキセタンカルボニル及びメチルテトラヒドロフランカルボニルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「 $C_1\sim C_6$ アルキル基」、同一又は異なった1乃至3個の「1乃至3個のハロゲン原子により置換された $C_1\sim C_6$ アルキル基」、同一又は異なった1乃至3個の前記「 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基」又は1個の前記「ハロゲン原子」が結合した前記「4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ベンゼン環と結合してもよい。）」であり、好適には、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1\sim C_4$ アルキル基」、同一又は異なった1又は2個の「1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換された $C_1\sim C_4$ アルキル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1\sim C_4$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ基」又は1個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子が結合した「環中に、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ベンゼン環と縮合してもよい、4乃至6員の飽和又は不飽和複素環が結合したカルボニル基」であり、より好適には、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1\sim C_3$ アルキル基」、同一又は異なった1又は2個の「1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換された $C_1\sim C_3$ アルキル基」、同一又は異なった1又は2個の前記「 $C_1\sim C_3$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基」又は1個の塩

素原子若しくはフッ素原子が結合した「環中に、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ベンゼン環と縮合してもよい、4乃至6員の飽和又は不飽和複素環が結合したカルボニル基」であり、更により好適には、同一又は異なった1又は2個のメチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ若しくはエトキシ基、1個のメチルチオ、エチルチオ、塩素原子若しくはフッ素原子が結合した、ベンゾジオキソールカルボニル、ピリジンカルボニル、N-モルフォリンカルボニル、オキセタンカルボニル、ピラゾールカルボニル、チアジアゾールカルボニル、ピリミジンカルボニル又はクロマンカルボニル基である。

本発明のR<sup>4</sup>及びAにおいて、「ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換された5若しくは6員複素環基」は、例えば、クロロピラゾリル、メチルピラゾリル、ジメチルピラゾリル、クロロメチルピラゾリル、クロロピリジル、フルオロピリジル、メチルピリジル、クロロピリミジニル、メチルピリミジニル、メチルテトラヒドロフラニル、メチルテトラヒドロピラニル、メチルジオキサニル、メチルチエニル、クロロチエニル、メチルフラニル及びメチルイソキサゾリルのような、前記「ハロゲン原子」及び前記「C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した前記「5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）」であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した「環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子及び前記「C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した「環に1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」であり、更により好適には、1個の塩素原子、フッ素原子、メチル基又はエチル基が置換したピリジル基、チエニル基又はテトラヒドロフラニル基である。

本発明のR<sup>4</sup>において、「1乃至3個のハロゲン原子、1個のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオ基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基によ

り置換されてよい。)又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)により置換された $C_2\sim C_8$ アルコキシカルボニル基」は、例えば、2-メトキシエトキシカルボニル、2-イソプロポキシエトキシカルボニル、2-フェノキシエトキシカルボニル、2-メチルチオエトキシカルボニル、2-テトラヒドロフランメトキシカルボニル、3-クロロ-2, 2-ジメチルプロポキシカルボニル、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニルのような、同一又は異なった1乃至3個の前記「ハロゲン原子」、1個の前記「 $C_1\sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ基」、1個のフェニル基、1個の前記「ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されたフェニル基」、1個の前記「5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子若しくは窒素原子を含有する。)」又は1個の前記「ハロゲン原子及び $C_1\sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換された5若しくは6員複素環基」により置換された前記「 $C_2\sim C_8$ アルコキシカルボニル基」であり、好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の前記「 $C_1\sim C_4$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ基」、1個のフェニル基、1個の前記「塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されたフェニル基」、1個の「環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」又は1個の「塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基により置換された環に1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」により置換された前記「 $C_2\sim C_8$ アルコキシカルボニル基」であり、より好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の前記「 $C_1\sim C_3$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基」、1個のフェニル基又は1個の「環に1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する飽和又は不飽和の5若しくは6員複素環基」により置換された前記



「 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基」であり、更により好適には、同一の1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基」、1個のフェニル基又は1個のピリジル基、チエニル基若しくはテトラヒドロフラニル基により置換された前記「 $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基」である。

本発明において、「 $C_4 \sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基」は、例えば、シクロプロポキシカルボニル、シクロブトキシカルボニル、シクロペントキシカルボニル及びシクロヘキシルオキシカルボニルのような、炭素数が3乃至6個であるシクロアルコキシ基が結合したカルボニル基であり、好適には、炭素数が4乃至6個であるシクロアルコキシ基が結合したカルボニル基（ $C_5 \sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基）であり、より好適には、炭素数が5又は6個であるシクロアルコキシ基が結合したカルボニル基（ $C_6 \sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基）であり、更により好適には、シクロペントキシカルボニル基である。

本発明において、「 $C_3 \sim C_7$ アルケニルオキシカルボニル基」は、例えば、ビニルオキシカルボニル、2-プロペニルオキシカルボニル、1-メチル-2-プロペニルオキシカルボニル、2-メチル-2-プロペニルオキシカルボニル、2-ブテニルオキシカルボニル、3-メチル-2-ブテニルオキシカルボニル、1-メチル-2-ブテニルオキシカルボニル、3-ブテニルオキシカルボニル、2-ペンテニルオキシカルボニル及び5-ヘキセニルオキシカルボニルのような、炭素数が2乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基が結合したカルボニル基であり、好適には、炭素数が3乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基が結合したカルボニル基（ $C_4 \sim C_7$ アルケニルオキシカルボニル基）であり、より好適には、炭素数が3乃至5個である直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基が結合したカルボニル基（ $C_4 \sim C_6$ アルケニルオキシカルボニル基）であり、更により好適には、炭素数が3又は4個である直鎖又は分岐鎖アルケニルオキシ基が結合したカルボニル基（ $C_4 \sim C_5$ アルケニルオキシカルボニル基）であり、特に好適には、イソプロポキシカルボニル基又はブトキシカルボニル基である。

本発明において、「 $C_3 \sim C_7$ アルキニルオキシカルボニル基」は、例えば、プロパルギルオキシカルボニル、1, 1-ジメチルプロパルギルオキシカルボニル、3

ーブチニルオキシカルボニル、4-ペンチニルオキシカルボニル及び2-ヘキシニルオキシカルボニルのような、炭素数が2乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルキニルオキシ基が結合したカルボニル基であり、好適には、炭素数が2乃至5個である直鎖又は分岐鎖アルキニルオキシ基が結合したカルボニル基 ( $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシカルボニル基) であり、より好適には、炭素数が3乃至5個である直鎖又は分岐鎖アルキニルオキシ基が結合したカルボニル基 ( $C_4 \sim C_6$ アルキニルオキシカルボニル基) であり、更により好適には、メチルブチニル基である。

本発明において、「( $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ)カルボニル基」は、例えば、(メチルチオ)カルボニル、(エチルチオ)カルボニル、(プロピルチオ)カルボニル、(イソプロピルチオ)カルボニル、(ブチルチオ)カルボニル、(イソブチルチオ)カルボニル、(sec-ブチルチオ)カルボニル、(tert-ブチルチオ)カルボニル、(ペンチルチオ)カルボニル、(2-メチルブチルチオ)カルボニル、(1-メチルペンチルチオ)カルボニル、(ネオペンチルチオ)カルボニル、(ヘキシルチオ)カルボニル、(1-メチルヘキシルチオ)カルボニル、(3, 3-ジメチルブチルチオ)カルボニル及び(2, 2-ジメチルブチルチオ)カルボニルのような、炭素数1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したカルボニル基であり、好適には、炭素数1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したカルボニル基であり、より好適には、炭素数1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したカルボニル基であり、炭素数が1又は2個であるアルキルチオ基が結合したカルボニル基であり、より好適には、(メチルチオ)カルボニル基である。

本発明において、「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれた1乃至5個の置換基により置換された(フェニルチオ)カルボニル基」は、例えば、(クロロフェニルチオ)カルボニル、(ジクロロフェニルチオ)カルボニル、(トリクロロフェニルチオ)カルボニル、(フルオロフェニルチオ)カルボニル、(ジフルオロフェニルチオ)カルボニル、(トリフルオロフェニルチオ)カルボニル、(ペンタフルオロフェニルチオ)カルボニル、(プロモフェニルチオ)カルボニル、(ヨードフェニルチオ)カルボニル、(クロロフルオロフェニルチオ)カルボニル、(メチルフェニルチオ)カルボニル、(エチルフェニルチオ)カルボニル、

(プロピルフェニルチオ)カルボニル、(イソプロピルフェニルチオ)カルボニル、(ブチルフェニルチオ)カルボニル、(tert-ブチルフェニルチオ)カルボニル、(ペンチルフェニルチオ)カルボニル及び(ヘキシルフェニルチオ)カルボニルのような、前記「ハロゲン原子」及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基が置換したフェニルチオ基が結合したカルボニル基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換した(フェニルチオ)カルボニル基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子及び前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した(フェニルチオ)カルボニル基であり、より好適には、1個の塩素原子、フッ素原子又はメチル基が置換した(フェニルチオ)カルボニル基である。

本発明において、「( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)チオカルボニル基」は、例えば、(メトキシ)チオカルボニル、(エトキシ)チオカルボニル、(プロポキシ)チオカルボニル、(イソプロポキシ)チオカルボニル、(ブトキシ)チオカルボニル、(イソブトキシ)チオカルボニル、(sec-ブトキシ)チオカルボニル、(tert-ブトキシ)チオカルボニル、(ペントキシ)チオカルボニル、(イソペントキシ)チオカルボニル、(2-メチルブトキシ)チオカルボニル、(ネオペントキシ)チオカルボニル、(1-エチルプロポキシ)チオカルボニル、(ヘキシルオキシ)チオカルボニル、(1-メチルペントキシ)チオカルボニル、(3, 3-ジメチルブトキシ)チオカルボニル、(1, 1-ジメチルブトキシ)チオカルボニル、(1, 2-ジメチルブトキシ)チオカルボニル及び(2-エチルブトキシ)チオカルボニルのような、炭素数が1乃至6個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が結合したチオカルボニル基であり、好適には、炭素数が1乃至4個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が結合したチオカルボニル基 { ( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)チオカルボニル基 } であり、より好適には、炭素数が1乃至3個である直鎖又は分岐鎖アルコキシ基が結合したチオカルボニル基 { ( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ)チオカルボニル基 } であり、更により好適には、(メトキシ)チオカルボニル基又は(エトキシ)チオカルボニル基である。

本発明において、「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換された(フェノキシ)チオカルボニル基」は、例えば、(クロロフェノキシ)チオカルボニル、(ジクロロフェノキシ)チオカルボニル、(トリクロロフェノキシ)チオカルボニル、(フルオロフェノキシ)チオカルボニル、(ジフルオロフェノキシ)チオカルボニル、(トリフルオロフェノキシ)チオカルボニル、(ペンタフルオロフェノキシ)チオカルボニル、(プロモフェノキシ)チオカルボニル、(ヨードフェノキシ)チオカルボニル、(クロロフルオロフェノキシ)チオカルボニル、(メチルフェノキシ)チオカルボニル、(エチルフェノキシ)チオカルボニル、(プロピルフェノキシ)チオカルボニル、(イソプロピルフェノキシ)チオカルボニル、(ブチルフェノキシ)チオカルボニル、(tert-ブチルフェノキシ)チオカルボニル、(ペンチルフェノキシ)チオカルボニル及び(ヘキシルフェノキシ)チオカルボニルのような、前記「ハロゲン原子」及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基が置換したフェノキシ基が結合したチオカルボニル基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換した(フェノキシ)チオカルボニル基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子及び前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換した(フェノキシ)チオカルボニル基であり、更により好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換した(フェノキシ)チオカルボニル基であり、特に好適には、(クロロフェノキシ)チオカルボニル基、(フルオロフェノキシ)チオカルボニル基又は(メチルフェノキシ)チオカルボニル基である。

本発明において、「 $C_2 \sim C_7$ アルキルジチオカルボニル基」は、例えば、メチルジチオカルボニル、エチルジチオカルボニル、プロピルジチオカルボニル、イソプロピルジチオカルボニル、ブチルジチオカルボニル、イソブチルジチオカルボニル、sec-ブチルジチオカルボニル、tert-ブチルジチオカルボニル、ペンチルジチオカルボニル、2-メチルブチルジチオカルボニル、1-メチルペンチルジチオカルボニル、ネオペンチルジチオカルボニル、ヘキシルジチオカルボニル、1-メチルヘ

キシルジチオカルボニル、3, 3-ジメチルブチルジチオカルボニル及び2, 2-ジメチルブチルジチオカルボニルのような、炭素数が1乃至6個の直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したチオカルボニル基であり、好適には、炭素数が1乃至5個の直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したチオカルボニル基 ( $C_2 \sim C_6$ アルキルジチオカルボニル基) であり、より好適には、炭素数が1乃至4個の直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したチオカルボニル基 ( $C_2 \sim C_5$ アルキルジチオカルボニル基) であり、更により好適には、炭素数が1乃至3個の直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基が結合したチオカルボニル基 ( $C_2 \sim C_4$ アルキルジチオカルボニル基) であり、特に好適には、メチルジチオカルボニル基又はエチルジチオカルボニル基である。

本発明において、「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されたフェニルジチオカルボニル基」は、例えば、クロロフェニルジチオカルボニル、ジクロロフェニルジチオカルボニル、トリクロロフェニルジチオカルボニル、フルオロフェニルジチオカルボニル、ジフルオロフェニルジチオカルボニル、トリフルオロフェニルジチオカルボニル、ペンタフルオロフェニルジチオカルボニル、プロモフェニルジチオカルボニル、ヨードフェニルジチオカルボニル、クロロフルオロフェニルジチオカルボニル、メチルフェニルジチオカルボニル、エチルフェニルジチオカルボニル、プロピルフェニルジチオカルボニル、イソプロピルフェニルジチオカルボニル、ブチルフェニルジチオカルボニル、tert-ブチルフェニルジチオカルボニル、ペンチルフェニルジチオカルボニル、ヘキシルフェニルジチオカルボニルのような、前記「ハロゲン原子」及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基が置換したフェニルチオ基が結合したチオカルボニル基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換したフェニルチオ基が結合したチオカルボニル基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子及び前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したフェニルジチオカルボニル基であり、より好適には、クロロフェニルジチオカルボニル基、フルオロフェニルジチオカルボニル基又はメチルフェニルジチオカル

ボニル基である。

本発明において、「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されたフェノキシ基」は、例えば、クロロフェノキシ、ジクロロフェノキシ、トリクロロフェノキシ、フルオロフェノキシ、ジフルオロフェノキシ、トリフルオロフェノキシ、ペンタフルオロフェノキシ、ブロモフェノキシ、ヨードフェノキシ、クロロフルオロフェノキシ、メチルフェノキシ、エチルフェノキシ、プロピルフェノキシ、イソプロピルフェノキシ、ブチルフェノキシ、tert-ブチルフェノキシ、ペンチルフェノキシ、ヘキシルフェノキシのような、前記「ハロゲン原子」及び前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基が置換したフェノキシ基であり、好適には、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基が置換したフェノキシ基であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子及び前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」からなる群から選ばれる同一又は異なった1又は2個の置換基が置換したフェノキシ基であり、更により好適には、クロロフェノキシ基、フルオロフェノキシ基又はメチルフェノキシ基である。

本発明の $R^4$ において、「1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ） $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基（当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又は $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基」は、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、ブトキシメチル、ペンチルオキシメチル、ヘキシルオキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシプロピル、4-シアノブチル、フェノキシメチル、2-フェノキシエチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチルのような、1個のフェニル基、1個の前記「ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換された

フェニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基」、1個のシアノ基、1個のフェノキシ基、1個の「ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されたフェノキシ基」又は1個の前記「 $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、1個のフェニル基、1個の前記「塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されたフェニル基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基」、1個のシアノ基、1個のフェノキシ基、1個の「塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されたフェノキシ基」又は1個の前記「 $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」であり、より好適には、1個のフェニル基、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、1個の前記「( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」、1個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基」、1個のシアノ基、1個のフェノキシ基又は1個の前記「 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基」が置換した前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」であり、更により好適には、メトキシメチル基である。

本発明において、「2つのアルキル基が、それらが結合する窒素原子と一緒になって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成するジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）カルバモイル基」は、例えば、N-モルホリンカルボニル、N-ピペリジンカルボニル、N-ピペラジンカルボニル、N-ピロリジンカルボニル及びN-ピラゾリンカルボニルのように、窒素原子とその両隣の炭素原子が飽和又は不飽和5若しくは6員複素環を形成し、当該窒素原子以外に更に1個の酸素原子又は窒素原子を含有する複素環が、当該窒素原子で結合するカルボニル基であり、好適には、N-モルホリンカルボニル又はN-ピペリジンカルボニルである。

本発明において、「ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）チオカルバモイル基」は、例えば、ジメチルチオカルバモイル、エチルメチルチオカルバモイル、ジエチルチオカルバ

モイル、ジプロピルチオカルバモイル、ジイソプロピルチオカルバモイル、ジブチルチオカルバモイル、ジペンチルチオカルバモイル及びジヘキシルチオカルバモイルのような、同一又は異なった2つの炭素数が1乃至6である直鎖又は分岐鎖アルキル基が窒素原子に結合したチオカルバモイル基であり、好適には、同一又は異なった2つの炭素数が1乃至4である直鎖又は分岐鎖アルキル基が窒素原子に結合したチオカルバモイル基であり、より好適には、同一又は異なった2つの炭素数が1乃至3である直鎖又は分岐鎖アルキル基が窒素原子に結合したチオカルバモイル基であり、更により好適には、同一の2つの炭素数が1又は2であるアルキル基が窒素原子に結合したチオカルバモイル基である。

本発明において、「2つのアルキル基が、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成するジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）チオカルバモイル基」は、例えば、N-モルホリンチオカルボニル、N-ピペリジンチオカルボニル、N-ピペラジンチオカルボニル、N-ピロリジンチオカルボニル及びN-ピラゾリンチオカルボニルのように、窒素原子とその両隣の炭素原子が飽和又は不飽和5若しくは6員複素環を形成し、当該窒素原子以外に更に1個の酸素原子又は窒素原子を含有する複素環が、当該窒素原子で結合するチオカルボニル基であり、好適には、N-モルホリンチオカルボニル又はN-ピペリジンチオカルボニルである。

本発明において、「ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ）チオホスホリル基」とは、例えば、ジ（メトキシ）チオホスホリル、ジ（エトキシ）チオホスホリル、ジ（プロポキシ）チオホスホリル、ジ（イソプロポキシ）チオホスホリル、ジ（ブトキシ）チオホスホリル、ジ（イソブトキシ）チオホスホリル、ジ（sec-ブトキシ）チオホスホリル、ジ（tert-ブトキシ）チオホスホリル、ジ（ペントキシ）チオホスホリル、ジ（イソペントキシ）チオホスホリル、ジ（2-メチルブトキシ）チオホスホリル、ジ（ネオペントキシ）チオホスホリル、ジ（1-エチルプロポキシ）チオホスホリル、ジ（ヘキシルオキシ）チオホスホリル、ジ（1-メチルペントキシ）チオホスホリル、ジ（3, 3-ジメチルブトキシ）チオホスホリル、ジ（1, 1-ジメチルブトキシ）チオホスホリル、ジ（1, 2-ジメチルブトキシ）チオホスホリル、ジ（2-エチルブトキシ）チオホスホリル、メトキシエトキシチオホスホリルのような、同一又



は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」が結合したチオホスホリル基であり、好適には、同一又は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基」が結合したチオホスホリル基であり、より好適には、同一又は異なった2個の前記「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基」が結合したチオホスホリル基であり、更により好適には、同一の2個の前記「 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基」が結合したチオホスホリル基である。

本発明のAにおいて、「1乃至13個のハロゲン原子により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基」とは、例えば、モノフルオロメチル、モノクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、モノフルオロエチル、モノフルオロヘキシル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロピル、ノナフルオロブチル、ウンデカフルオロペンチル及びトリデカフルオロヘキシルのような、同一又は異なった1乃至13個の前記「ハロゲン原子」が置換した前記「 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」であり、好適には、同一又は異なった1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_4$ アルキル基」であり、より好適には、同一又は異なった1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_3$ アルキル基」であり、更により好適には、3個のフッ素原子が置換した前記「 $C_1 \sim C_2$ アルキル基」であり、特に好適には、トリフルオロメチル基である。

本発明において、 $R^1$ は、好適には、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基《当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子、臭素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキル基により置換されてよい。））、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。））、1個の $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個のシアノ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1又は2個の塩素原子、フッ素原子、臭素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原

子又は臭素原子により置換されてよい。)により置換されてよい。)により置換されてよい。》、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基(当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、ベンゾイル基(当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基(当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)であり、

より好適には、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、1個の( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のシアノ基又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)}により置換されてよい。}、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_3$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホ

ニル基又はフェニルスルホニル基であり、

更により好適には、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基 {当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基又は1個の $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基により置換されてよい。} であり、

特に好適には、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基 (当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基により置換されてよい。) である。

本発明において、 $R^2$ 及び $R^3$ は、好適には、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基 {当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基 (当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の5若しくは6員複素環基 (当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。) により置換されてよい。}、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基 (当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基 (当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。) 又は5若しくは6員複素環基 {当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基 (当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。) からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。} を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環 {当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノ基、1個のメチレンジオキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ) イミノ基によ

り置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $\text{NR}^{6a}$ で表される基（式中、 $\text{R}^{6a}$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。）であり、

より好適には、同一又は異なって、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基及び $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ基、1個の（ $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ） $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ アルケニル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、1又は2個の $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ基により置換されてよい。）又は5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）を表し、又は、 $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、4乃至6員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環（当該環は、1又は2個の $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基、1個の $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ基、1個の（ $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ） $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ基、1個のジ（ $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル）アミノ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個の $\text{N}-（\text{C}_1\sim\text{C}_3\text{アルコキシ})$ イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $\text{NR}^{6b}$ で表される基（式中、 $\text{R}^{6b}$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。）であり、

更により好適には、同一又は異なって、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル基を表し、又は、 $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロヘキサン環（当該シクロヘキサン環は、1又は2個の $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル基、1個の $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルコキシ基、1個の（ $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルコキシ） $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルコキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個の $\text{N}-（\text{C}_1\sim\text{C}_2\text{アルコキシ})$ イミノ基により置換されてよい。）であり、

特に好適には、共に、メチル基を表し、又は、 $\text{R}^2$ 及び $\text{R}^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロヘキサン環（当該シクロヘキサン環は、1個

の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基又はN-  
( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)イミノ基により置換されてよい。)であり、

最も好適には、共に、メチル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合して  
いる炭素原子と一緒にあって、メトキシシクロヘキサン環である。

本発明において、 $R^4$ は、好適には、水素原子、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基(当  
該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、  
1個の $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1  
個のフェノキシ基により置換されてよい。)、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル  
基{当該シクロアルキルカルボニル基は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、塩素原子、フッ素  
原子及び臭素原子からなる群から選ばれる1乃至4個の置換基、1又は2個の $C_1$   
 $\sim C_4$ アルコキシ基、1又は2個のシアノ基又は1個のフェニル基(当該フェニル  
基は、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基により置換されてよい。)}により置換されてよ  
い。}、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルカルボニル基(当該アルケニルカルボニル基は、1乃  
至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、ベンゾイ  
ル基{当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又  
は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)からなる群から選ばれる1乃至3  
個の置換基、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボ  
ニルオキシ基、1個の $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキル  
チオ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホ  
ニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換され  
てよい。}、4乃至6員複素環カルボニル基{当該複素環カルボニル基は、1乃至  
3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置  
換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキル  
チオ基又は1個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子により置換されてよく、  
ベンゼン環と縮合してもよい。}、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基{当該アルコ  
キシカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個

の $C_1\sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_1\sim C_4$ アルキルチオ基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_5\sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基、 $C_4\sim C_7$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_4\sim C_7$ アルキニルオキシカルボニル基、（ $C_1\sim C_4$ アルキルチオ）カルボニル基、（フェニルチオ）カルボニル基（当該（フェニルチオ）カルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、（ $C_1\sim C_4$ アルコキシ）チオカルボニル基、（フェノキシ）チオカルボニル基（当該（フェノキシ）チオカルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2\sim C_6$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基（当該フェニルジチオカルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1\sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル基及び $C_1\sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ基、（ $C_1\sim C_4$ アルコキシ） $C_1\sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基（当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又は $C_2\sim C_5$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。）、 $C_3\sim C_5$ アルケニル基、 $C_3\sim C_5$ アルキニル基、ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、そ

れらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又はジ（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ）チオホスホリル基であり、

より好適には、水素原子、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基（当該シクロアルキルカルボニル基は、1乃至4個の $C_1 \sim C_3$ アルキル基、塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のシアノ基又は1個のフェニル基（当該フェニル基は、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルカルボニル基（当該アルケニルカルボニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子及び $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。）、4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基又は1個の塩素原子若しくはフッ素原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。）、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基（当該アルコキシカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1個

のフェニル基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_6 \sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基、 $C_4 \sim C_6$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_4 \sim C_6$ アルキニルオキシカルボニル基、（ $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ）カルボニル基、（フェニルチオ）カルボニル基、（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ）チオカルボニル基、（フェノキシ）チオカルボニル基、 $C_2 \sim C_5$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ） $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基又は $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、ジ（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基又はジ（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ）チオホスホリル基であり、

更により好適には、水素原子、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基（当該シクロプロピルカルボニル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルキル基により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_4$ アルケニルカルボニル基、ベンゾイル基又は $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基であり、

特に好適には、水素原子、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基（当該シクロプロピルカルボニル基は、1個のメチル基により置換されてよい。）又は $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基である。

本発明において、Aは、好適には、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至



3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基(当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)であり、

より好適には、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基であり、  
更により好適には、メチル基又は塩素原子であり、  
特に好適には、メチル基である。

本発明において、 $n$ は、好適には、2又は3である。特に、置換基Aの置換位置は2, 4-, 2, 6-, 2, 3, 6-又は2, 4, 6-が好適である。

本発明において、 $X$ は、好適には、酸素原子又は硫黄原子であり、より好適には、酸素原子である。

本発明の化合物(I)は、分子中に水酸基を有する場合、例えば、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩又はアンモニウム塩にすることができ、又、分子中に塩基性部分がある場合には、例えば、硫酸塩、塩酸塩、硝酸塩、リン酸塩のような塩にすることができる。それらの塩は、農園芸用の除草剤として使用できるかぎり、本発明に包含される。

本発明において、「アルカリ金属塩」とは、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、

リチウム塩が挙げられ、好適には、ナトリウム塩又はカリウム塩である。

本発明において、「アルカリ土類金属塩」とは、例えば、カルシウム塩、マグネシウム塩が挙げられ、好適には、カルシウム塩である。

本発明化合物の水和物も、本発明に包含されるものである。

本発明化合物中には、不斉炭素を有する化合物もあり、その場合には、本願発明は、一種の光学活性体及び数種の光学活性体の任意の割合の混合物をも包含する。

本発明の化合物 (I) は、

(a) 好適には、 $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基《当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、1個の $C_3 \sim C_5$ アルケニルオキシ基、1個の( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個のシアノ基、1個のジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基 {当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。} により置換されてよい。》、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基 {当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）により置換されてよい。}、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素

原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、ベンゾイル基(当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基(当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基(当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ) $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。)により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。))又は5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。))を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環(当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ) $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノ基、1個のメチレンジオキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又

は1個のN- ( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ) イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^{6a}$ で表される基 (式中、 $R^{6a}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表す。) により中断されていてよい。) であり、

$R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基 (当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基 (当該シクロアルキルカルボニル基は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、塩素原子、フッ素原子及び臭素原子からなる群から選ばれる1乃至4個の置換基、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1又は2個のシアノ基又は1個のフェニル基 (当該フェニル基は、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基により置換されてよい。) により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルカルボニル基 (当該アルケニルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、ベンゾイル基 (当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基 (当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。) からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。)、4乃至6員複素環カルボニル基 (当該複素環カルボニル基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基 (当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基又は1個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。)、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基 (当該アルコキシカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1個のフェニル基 (当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換

基により置換されてよい。)又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)により置換されてよい。)、 $C_5\sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基、 $C_4\sim C_7$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_4\sim C_7$ アルキニルオキシカルボニル基、( $C_1\sim C_4$ アルキルチオ)カルボニル基、(フェニルチオ)カルボニル基(当該(フェニルチオ)カルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、( $C_1\sim C_4$ アルコキシ)チオカルボニル基、(フェノキシ)チオカルボニル基(当該(フェノキシ)チオカルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、 $C_2\sim C_6$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基(当該フェニルジチオカルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、 $C_1\sim C_4$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の、フェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル基及び $C_1\sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ基、( $C_1\sim C_4$ アルコキシ) $C_1\sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基(当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1\sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)}又は $C_2\sim C_5$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。)、 $C_3\sim C_5$ アルケニル基、 $C_3\sim C_5$ アルキニル基、ジ( $C_1\sim C_4$ アルキル)カルバモイル基{当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環(当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。)}を形成してよい。)、ジ( $C_1\sim C_4$ アルキル)チオカルバモイル基{当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環(当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。)}を形成してよい。)、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル基、フ

フェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又はジ（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ）チオホスホリル基であり、

Aが、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基（当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）であり、

nが、1、2、3、4又は5であり、

Xが、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基である化合物であり、

(b) より好適には、 $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、1個の（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ） $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のシアノ基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、 $C_2$

～C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、ジ (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル) カルバモイル基、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基であり、

R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>が、同一又は異なって、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基 (当該アルキル基は、1個のC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル基、1個のフェニル基 (当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基及びC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基、1個の (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ) C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個の5若しくは6員複素環基 (当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。) により置換されてよい。)、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>～C<sub>4</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>4</sub>アルキニル基、フェニル基 (当該フェニル基は、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基により置換されてよい。)) 又は5若しくは6員複素環基 (当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)) を表し、又は、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、4乃至6員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環 (当該環は、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基、1個の (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ) C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基、1個のジ (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル) アミノ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN- (C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ) イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式NR<sup>6b</sup>で表される基 (式中、R<sup>6b</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基を表す。)) により中断されていてよい。) であり、

R<sup>4</sup>が、水素原子、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基 (当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のC<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニルオキシ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルカルボニル基 (当該シクロアルキルカルボニル基は、1乃至4個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル基、塩素原子若しくはフッ素原子、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基、1個のシアノ基又は1個のフェニル基 (当該フェニル基は、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ基により置換されてよい。)) により置換されてよい。)、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>アルケニルカルボニル基 (当該アルケニルカルボニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、ベンゾイル基 (当該ベンゾイ

ル基は、塩素原子、フッ素原子及び $C_1\sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基、1又は2個の $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_2\sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_2\sim C_4$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基、1個の $C_1\sim C_3$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1\sim C_3$ アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。）、4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1又は2個の $C_1\sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基又は1個の塩素原子若しくはフッ素原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。）、 $C_2\sim C_8$ アルコキシカルボニル基（当該アルコキシカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基、1個のフェニル基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_6\sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基、 $C_4\sim C_6$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_4\sim C_6$ アルキニルオキシカルボニル基、（ $C_1\sim C_3$ アルキルチオ）カルボニル基、（フェニルチオ）カルボニル基、（ $C_1\sim C_3$ アルコキシ）チオカルボニル基、（フェノキシ）チオカルボニル基、 $C_2\sim C_5$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基、 $C_1\sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、（ $C_1\sim C_3$ アルコキシ） $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基又は $C_2\sim C_4$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。）、 $C_3\sim C_4$ アルケニル基、 $C_3\sim C_4$ アルキニル基、ジ（ $C_1\sim C_3$ アルキル）カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ（ $C_1\sim C_3$ アルキル）チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員



複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基又はジ（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ）チオホスホリル基であり、

Aが、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基であり、

nが、1、2、3、4又は5であり、

Xが、酸素原子又は硫黄原子である化合物であり、

(c) 更により好適には、 $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_2$ アルコキシ） $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基又は1個の $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基により置換されてよい。）であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロヘキサン環（当該シクロヘキサン環は、1又は2個の $C_1 \sim C_2$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_2$ アルコキシ） $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-（ $C_1 \sim C_2$ アルコキシ）イミノ基により置換されてよい。）であり、

$R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基（当該シクロプロピルカルボニル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルキル基により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_4$ アルケニルカルボニル基、ベンゾイル基又は $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基であり、

Aが、メチル基又は塩素原子であり、

nが、2又は3であり、

Xが、酸素原子又は硫黄原子である化合物であり、

(d) 特に好適には、 $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基により置換されてよい。）であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、共に、メチル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合して

いる炭素原子と一緒にあって、シクロヘキサン環〔当該シクロヘキサン環は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基又はN-( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)イミノ基により置換されてよい。〕であり、

$R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基（当該シクロプロピルカルボニル基は、1個のメチル基により置換されてよい。）又は $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基であり、

Aが、メチル基であり、

nが、2又は3であり、

Xが、酸素原子又は硫黄原子である化合物である。

本発明の化合物（I I）は、

（a'）好適には、 $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基〔当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、1個の $C_3 \sim C_5$ アルケニルオキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個のシアノ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基〔当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。〕により置換されてよい。〕、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基〔当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素

原子を含有し、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又は5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環（当該環は、1乃至

3個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ) $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノ基、1個のメチレンジオキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-( $C_1 \sim C_4$ アルコキシ)イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^{6a}$ で表される基(式中、 $R^{6a}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表す。)により中断されていてよい。}であり、

$R^5$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、

Aが、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基(当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)であり、

nが、1、2、3、4又は5であり、

Xが、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基である化合物であり、

(b')より好適には、 $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、1個の( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のシアノ基又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)により置換されてよい。}、C

$_3\sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3\sim C_4$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、 $C_3\sim C_4$ アルキニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）、 $C_2\sim C_6$ アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、 $C_2\sim C_4$ アルコキシカルボニル基、ジ（ $C_1\sim C_3$ アルキル）カルバモイル基、 $C_1\sim C_3$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1\sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_3\sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、 $C_1\sim C_3$ アルキル基及び $C_1\sim C_3$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1個の（ $C_1\sim C_3$ アルコキシ） $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3\sim C_4$ アルケニル基、 $C_3\sim C_4$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、1又は2個の $C_1\sim C_3$ アルコキシ基により置換されてよい。）又は5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至6員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環（当該環は、1又は2個の $C_1\sim C_3$ アルキル基、1個の $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1個の（ $C_1\sim C_3$ アルコキシ） $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、1個のジ（ $C_1\sim C_3$ アルキル）アミノ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-（ $C_1\sim C_3$ アルコキシ）イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^{6b}$ で表される基（式中、 $R^{6b}$ は、 $C_1\sim C_3$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。）であり、

$R^5$ が、 $C_1\sim C_3$ アルキル基であり、

Aが、 $C_1\sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1\sim C_3$ アルキルチオ基、 $C_1\sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子

子を含む。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基であり、

$n$ が、1、2、3、4又は5であり、

$X$ が、酸素原子又は硫黄原子である化合物であり、

(c') 更により好適には、 $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基 (当該アルキル基は、1個の  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の ( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基又は1個の  $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基により置換されてよい。) であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロヘキサン環 (当該シクロヘキサン環は、1又は2個の  $C_1 \sim C_2$ アルキル基、1個の  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の ( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個の  $N-(C_1 \sim C_2$ アルコキシ) イミノ基により置換されてよい。) であり、

$R^5$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基であり、

$A$ が、メチル基又は塩素原子であり、

$n$ が、2又は3であり、

$X$ が、酸素原子又は硫黄原子である化合物であり、

(d') 特に好適には、 $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基 (当該アルキル基は、1個の  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基により置換されてよい。) であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、共に、メチル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロヘキサン環 (当該シクロヘキサン環は、1個の  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基又は  $N-(C_1 \sim C_2$ アルコキシ) イミノ基により置換されてよい。) であり、

$R^5$ が、メチル基であり、

$A$ が、メチル基であり、

$n$ が、2又は3であり、

$X$ が、酸素原子又は硫黄原子である化合物である。

本発明の化合物 (I I I) は、

(a'') 好適には、 $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基 (当該アルキル基は、1

個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、1個の $C_3 \sim C_5$ アルケニルオキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個のシアノ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1

個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又は5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環（当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノ基、1個のメチレンジオキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ）イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^{6a}$ で表される基（式中、 $R^{6a}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。）であり、

$R^6$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、

Aが、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素



原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基(当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)であり、

$n$ が、1、2、3、4又は5であり、

$X$ が、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基である化合物であり、

(b")より好適には、 $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、1個の( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のシアノ基又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。))により置換されてよい。}、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_3$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又

は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)により置換されてよい。}、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、フェニル基(当該フェニル基は、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基により置換されてよい。)又は5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至6員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環(当該環は、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のジ( $C_1 \sim C_3$ アルキル) アミノ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^{6b}$ で表される基(式中、 $R^{6b}$ は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基を表す。)により中断されていてよい。)であり、

$R^6$ が、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基であり、

Aが、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基であり、

nが、1、2、3、4又は5であり、

Xが、酸素原子又は硫黄原子である化合物であり、

(c") 更により好適には、 $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基(当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基又は1個の $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基により置換されてよい。)であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロヘキサン環(当該シクロヘキサン環は、1又は2個の $C_1 \sim C_2$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ) イミノ基により置換されてよい。)であり、

$R^5$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基であり、

Aが、メチル基又は塩素原子であり、

nが、2又は3であり、

Xが、酸素原子又は硫黄原子である化合物であり、

(d'') 特に好適には、 $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基により置換されてよい。）であり、

$R^2$ 及び $R^3$ が、共に、メチル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロヘキサン環（当該シクロヘキサン環は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基又はN-（ $C_1 \sim C_2$ アルコキシ）イミノ基により置換されてよい。）であり、

$R^5$ が、メチル基であり、

Aが、メチル基であり、

nが、2又は3であり、

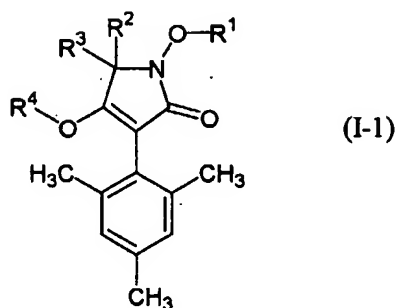
Xが、酸素原子又は硫黄原子である化合物である。

本発明の代表的化合物を下記表1～12に例示するが、本発明はこれらの化合物に限定されるものではない。

以下、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「iPr」はイソプロピル基を、「cPr」はシクロプロピル基を、「cPr(1-Me, 2, 2-Cl<sub>2</sub>)」は1-メチル-2, 2-ジクロロシクロプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「tBu」はtert-ブチル基を、「iBu」はイソブチル基を、「sBu」はsec-ブチル基を、「cBu」はシクロブチル基を、「cPent」はシクロペンチル基を、「cHex」はシクロヘキシル基を、「2, 6-Cl<sub>2</sub>, 4-CF<sub>3</sub>」は2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル基を、「Ac」はアセチル基を、「Ph」はフェニル基を、「2-Cl-Ph」は2-クロロフェニル基を、「Tol」はトリル基を、「2-Thf」は2-テトラヒドロフラン基を、「2-Diox」は2-ジオキサニル基を、「3-Pyr」は3-ピリジル基を、「5-Pym」は5-ピリミジニル基を、「2-SMe, 4-CF<sub>3</sub>-5-Pym」は2-メチルチオ-4-トリフルオロメチル-5-ピリミジニル基を、「4-Pyza」は4-ピラゾリル基を、「2-Thiophene」は2-チエニル基を、「5-Me-6-Chr」は5-メチルクロマン-6-イル基を、「N-Mor」

はN-モルホリニル基を、「5-Q<sup>1</sup>」はベンゾ[1,3]ジオキサソール-5-イル基を、「5-Q<sup>2</sup>」は[1,2,3]チアジアソール-5-イル基を、「3-Q<sup>3</sup>」はオキセタン-3-イル基を、「2-Q<sup>4</sup>」は1,3-ジオキサソ-2-イル基を、「NH<sub>4</sub><sup>+</sup>」は基OR<sup>4</sup>が式O<sup>-</sup>NH<sub>4</sub><sup>+</sup>で表されるアンモニウム塩であることを、それぞれ示す。

表 1



| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>          |
|-------|----------------|----------------|----------------|-------------------------|
| 1-1   | H              | Me             | Me             | H                       |
| 1-2   | H              | Me             | Me             | Ac                      |
| 1-3   | H              | Me             | Me             | COEt                    |
| 1-4   | H              | Me             | Me             | COPh                    |
| 1-5   | H              | Me             | Me             | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 1-6   | H              | Me             | Me             | COtBu                   |
| 1-7   | H              | Me             | Me             | COC(Me) <sub>2</sub> Et |
| 1-8   | H              | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> Me      |
| 1-9   | H              | Me             | Me             | C(S)SEt                 |
| 1-10  | H              | Me             | Me             | C(S)SPr                 |
| 1-11  | H              | Me             | Me             | CH <sub>2</sub> OMe     |
| 1-12  | H              | Me             | Me             | CH <sub>2</sub> OPh     |
| 1-13  | Me             | Me             | Me             | H                       |
| 1-14  | Me             | Me             | Me             | Ac                      |
| 1-15  | Me             | Me             | Me             | COEt                    |
| 1-16  | Me             | Me             | Me             | COPr                    |

|      |    |    |    |   |
|------|----|----|----|---|
| 1-17 | Me | Me | Me | COiPr   |
| 1-18 | Me | Me | Me | COBu  |
| 1-19 | Me | Me | Me | COtBu   |
| 1-20 | Me | Me | Me | COcHex  |
| 1-21 | Me | Me | Me | COPh  |
| 1-22 | Me | Me | Me | CO(2-Cl-Ph)   |
| 1-23 | Me | Me | Me | COCH=CH <sub>2</sub>  |
| 1-24 | Me | Me | Me | COC(Me)=CH <sub>2</sub>   |
| 1-25 | Me | Me | Me | COCH <sub>2</sub> OMe   |
| 1-26 | Me | Me | Me | COCH <sub>2</sub> OPh   |
| 1-27 | Me | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 1-28 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> Me  |
| 1-29 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> Et  |
| 1-30 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> Pr  |
| 1-31 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> iPr   |
| 1-32 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> Bu  |
| 1-33 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> iBu   |
| 1-34 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> tBu   |
| 1-35 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> cPent   |
| 1-36 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> cHex  |
| 1-37 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                    |
| 1-38 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 1-39 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-Thf)                               |
| 1-40 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 1-41 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH(Me)iPr   |
| 1-42 | Me | Me | Me | C(O)SMe   |
| 1-43 | Me | Me | Me | C(O)SEt   |
| 1-44 | Me | Me | Me | C(O)S-tBu   |
| 1-45 | Me | Me | Me | C(O)SPh   |

|      |    |    |    |                              |
|------|----|----|----|------------------------------|
| 1-46 | Me | Me | Me | C(S)OMe                      |
| 1-47 | Me | Me | Me | C(S)OEt                      |
| 1-48 | Me | Me | Me | C(S)OtBu                     |
| 1-49 | Me | Me | Me | C(S)OPh                      |
| 1-50 | Me | Me | Me | C(S)SMe                      |
| 1-51 | Me | Me | Me | C(S)SEt                      |
| 1-52 | Me | Me | Me | C(S)SPr                      |
| 1-53 | Me | Me | Me | C(S)S-iPr                    |
| 1-54 | Me | Me | Me | C(S)SBu                      |
| 1-55 | Me | Me | Me | C(S)S-tBu                    |
| 1-56 | Me | Me | Me | C(S)SCH <sub>2</sub> tBu     |
| 1-57 | Me | Me | Me | C(S)SPh                      |
| 1-58 | Me | Me | Me | Me                           |
| 1-59 | Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe          |
| 1-60 | Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPh          |
| 1-61 | Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> Ph           |
| 1-62 | Me | Me | Me | SO <sub>2</sub> Me           |
| 1-63 | Me | Me | Me | SO <sub>2</sub> Et           |
| 1-64 | Me | Me | Me | SO <sub>2</sub> Ph           |
| 1-65 | Me | Me | Me | SO <sub>2</sub> (4-Me-Ph)    |
| 1-66 | Me | Me | Me | P(S)(OMe) <sub>2</sub>       |
| 1-67 | Me | Me | Me | P(S)(OEt) <sub>2</sub>       |
| 1-68 | Me | Me | Me | Na                           |
| 1-69 | Me | Me | Me | K                            |
| 1-70 | Me | Me | Me | NH <sub>4</sub> <sup>+</sup> |
| 1-71 | Et | Me | Me | H                            |
| 1-72 | Et | Me | Me | COtBu                        |
| 1-73 | Et | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 1-74 | Et | Me | Me | C(S)SEt                      |

|       |                                    |    |    |                       |
|-------|------------------------------------|----|----|-----------------------|
| 1-75  | Pr                                 | Me | Me | H                     |
| 1-76  | Pr                                 | Me | Me | COtBu                 |
| 1-77  | Pr                                 | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-78  | Pr                                 | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-79  | iPr                                | Me | Me | H                     |
| 1-80  | iPr                                | Me | Me | COtBu                 |
| 1-81  | iPr                                | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-82  | iPr                                | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-83  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | H                     |
| 1-84  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | COtBu                 |
| 1-85  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-86  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-87  | CH <sub>2</sub> C≡CH               | Me | Me | H                     |
| 1-88  | CH <sub>2</sub> C≡CH               | Me | Me | COtBu                 |
| 1-89  | CH <sub>2</sub> C≡CH               | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-90  | CH <sub>2</sub> C≡CH               | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-91  | CH <sub>2</sub> cHex               | Me | Me | H                     |
| 1-92  | CH <sub>2</sub> cHex               | Me | Me | COtBu                 |
| 1-93  | CH <sub>2</sub> cHex               | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-94  | CH <sub>2</sub> cHex               | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-95  | CH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | H                     |
| 1-96  | CH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | COtBu                 |
| 1-97  | CH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-98  | CH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-99  | CH <sub>2</sub> OMe                | Me | Me | H                     |
| 1-100 | CH <sub>2</sub> OMe                | Me | Me | Ac                    |
| 1-101 | CH <sub>2</sub> OMe                | Me | Me | COEt                  |
| 1-102 | CH <sub>2</sub> OMe                | Me | Me | COPr                  |
| 1-103 | CH <sub>2</sub> OMe                | Me | Me | COiPr                 |

|       |                     |    |    |   |
|-------|---------------------|----|----|---|
| 1-104 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COBu  |
| 1-105 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COtBu   |
| 1-106 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcHex  |
| 1-107 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COPh  |
| 1-108 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCH=CH <sub>2</sub>  |
| 1-109 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCH <sub>2</sub> OMe   |
| 1-110 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCH <sub>2</sub> OPh   |
| 1-111 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 1-112 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COC(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl                               |
| 1-113 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> Me  |
| 1-114 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> Et  |
| 1-115 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> Pr  |
| 1-116 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> iPr   |
| 1-117 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> Bu  |
| 1-118 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> iBu   |
| 1-119 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> tBu   |
| 1-120 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> cPent   |
| 1-121 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> cHex  |
| 1-122 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                    |
| 1-123 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 1-124 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-Thf)                               |
| 1-125 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 1-126 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH(Me)iPr   |
| 1-127 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)SMe   |
| 1-128 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)SEt   |
| 1-129 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)SPr   |
| 1-130 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)S-iPr   |
| 1-131 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)SBu   |
| 1-132 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)S-tBu   |



|       |  |    |    |                          |
|-------|--|----|----|--------------------------|
| 1-133 | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Me | Me | C(S)SCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-134 | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Me | Me | C(S)SPh                  |
| 1-135 | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me | Me | H                        |
| 1-136 | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me | Me | COtBu                    |
| 1-137 | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |
| 1-138 | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me | Me | C(S)SEt                  |
| 1-139 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Me | Me | H                        |
| 1-140 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Me | Me | COtBu                    |
| 1-141 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |
| 1-142 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Me | Me | C(S)SEt                  |
| 1-143 | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | Me | Me | H                        |
| 1-144 | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COtBu                    |
| 1-145 | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |
| 1-146 | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | Me | Me | C(S)SEt                  |
| 1-147 | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Me | Me | H                        |
| 1-148 | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Me | Me | COtBu                    |
| 1-149 | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |
| 1-150 | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Me | Me | C(S)SEt                  |
| 1-151 | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | Me | Me | H                        |
| 1-152 | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | Me | Me | COtBu                    |
| 1-153 | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |
| 1-154 | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | Me | Me | C(S)SEt                  |
| 1-155 | CH <sub>2</sub> (2-Diox)                             | Me | Me | H                        |
| 1-156 | CH <sub>2</sub> (2-Diox)                             | Me | Me | COtBu                    |
| 1-157 | CH <sub>2</sub> (2-Diox)                             | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |
| 1-158 | CH <sub>2</sub> (2-Diox)                             | Me | Me | C(S)SEt                  |
| 1-159 | CH <sub>2</sub> (2-Thf)                              | Me | Me | H                        |
| 1-160 | CH <sub>2</sub> (2-Thf)                              | Me | Me | COtBu                    |
| 1-161 | CH <sub>2</sub> (2-Thf)                              | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu    |

|       |   |    |    |                       |
|-------|---|----|----|-----------------------|
| 1-162 | CH <sub>2</sub> (2-Thf)                             | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-163 | CH <sub>2</sub> (3-Pyr)                             | Me | Me | H                     |
| 1-164 | CH <sub>2</sub> (3-Pyr)                             | Me | Me | COtBu                 |
| 1-165 | CH <sub>2</sub> (3-Pyr)                             | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-166 | CH <sub>2</sub> (3-Pyr)                             | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-167 | CH <sub>2</sub> CN                                  | Me | Me | H                     |
| 1-168 | CH <sub>2</sub> CN                                  | Me | Me | COtBu                 |
| 1-169 | CH <sub>2</sub> CN                                  | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-170 | CH <sub>2</sub> CN                                  | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-171 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | H                     |
| 1-172 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | COtBu                 |
| 1-173 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-174 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph                 | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-175 | CH <sub>2</sub> Cl                                  | Me | Me | H                     |
| 1-176 | CH <sub>2</sub> Cl                                  | Me | Me | COtBu                 |
| 1-177 | CH <sub>2</sub> Cl                                  | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-178 | CH <sub>2</sub> Cl                                  | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-179 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Me | Me | H                     |
| 1-180 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Me | Me | COtBu                 |
| 1-181 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-182 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-183 | CH <sub>2</sub> OiPr                                | Me | Me | H                     |
| 1-184 | CH <sub>2</sub> OiPr                                | Me | Me | COtBu                 |
| 1-185 | CH <sub>2</sub> OiPr                                | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-186 | CH <sub>2</sub> OiPr                                | Me | Me | C (S) SEt             |
| 1-187 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | H                     |
| 1-188 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | COtBu                 |
| 1-189 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-190 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Me | Me | C (S) SEt             |

|       |                                  |    |    |                       |
|-------|----------------------------------|----|----|-----------------------|
| 1-191 | CH <sub>2</sub> CH=CHCl          | Me | Me | H                     |
| 1-192 | CH <sub>2</sub> CH=CHCl          | Me | Me | COtBu                 |
| 1-193 | CH <sub>2</sub> CH=CHCl          | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-194 | CH <sub>2</sub> CH=CHCl          | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-195 | CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> | Me | Me | H                     |
| 1-196 | CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> | Me | Me | COtBu                 |
| 1-197 | CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-198 | CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-199 | Ph                               | Me | Me | H                     |
| 1-200 | Ph                               | Me | Me | COtBu                 |
| 1-201 | Ph                               | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-202 | Ph                               | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-203 | 2-Pyr                            | Me | Me | H                     |
| 1-204 | 2-Pyr                            | Me | Me | COtBu                 |
| 1-205 | 2-Pyr                            | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-206 | 2-Pyr                            | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-207 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Pyr         | Me | Me | H                     |
| 1-208 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Pyr         | Me | Me | COtBu                 |
| 1-209 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Pyr         | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-210 | 4-CF <sub>3</sub> -2-Pyr         | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-211 | 2-Thiophene                      | Me | Me | H                     |
| 1-212 | 2-Thiophene                      | Me | Me | COtBu                 |
| 1-213 | 2-Thiophene                      | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-214 | 2-Thiophene                      | Me | Me | C(S)SEt               |
| 1-215 | Ac                               | Me | Me | COtBu                 |
| 1-216 | Ac                               | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-217 | COtBu                            | Me | Me | COtBu                 |
| 1-218 | COtBu                            | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-219 | COPh                             | Me | Me | COtBu                 |

|       |                       |    |                                    |                       |
|-------|-----------------------|----|------------------------------------|-----------------------|
| 1-220 | COPh                  | Me | Me                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-221 | COCH <sub>2</sub> tBu | Me | Me                                 | COtBu                 |
| 1-222 | COCH <sub>2</sub> tBu | Me | Me                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-223 | CO <sub>2</sub> Me    | Me | Me                                 | COtBu                 |
| 1-224 | CO <sub>2</sub> Me    | Me | Me                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-225 | CONMe <sub>2</sub>    | Me | Me                                 | COtBu                 |
| 1-226 | CONMe <sub>2</sub>    | Me | Me                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-227 | SO <sub>2</sub> Me    | Me | Me                                 | COtBu                 |
| 1-228 | SO <sub>2</sub> Me    | Me | Me                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-229 | SO <sub>2</sub> Tol   | Me | Me                                 | COtBu                 |
| 1-230 | SO <sub>2</sub> Tol   | Me | Me                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-231 | Me                    | Me | Et                                 | H                     |
| 1-232 | Me                    | Me | Et                                 | COtBu                 |
| 1-233 | Me                    | Me | Et                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-234 | Me                    | Me | Et                                 | C(S)SEt               |
| 1-235 | Me                    | Me | Pr                                 | H                     |
| 1-236 | Me                    | Me | Pr                                 | COtBu                 |
| 1-237 | Me                    | Me | Pr                                 | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-238 | Me                    | Me | Pr                                 | C(S)SEt               |
| 1-239 | Me                    | Me | iPr                                | H                     |
| 1-240 | Me                    | Me | iPr                                | COtBu                 |
| 1-241 | Me                    | Me | iPr                                | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-242 | Me                    | Me | iPr                                | C(S)SEt               |
| 1-243 | Me                    | Me | cPr                                | H                     |
| 1-244 | Me                    | Me | cPr                                | COtBu                 |
| 1-245 | Me                    | Me | cPr                                | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-246 | Me                    | Me | cPr                                | C(S)SEt               |
| 1-247 | Me                    | Me | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | H                     |
| 1-248 | Me                    | Me | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | COtBu                 |

|       |    |  |                                    |                           |
|-------|----|--|------------------------------------|---------------------------|
| 1-249 | Me | Me   | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-250 | Me | Me   | $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-251 | Me | Me   | Ph                                 | H                         |
| 1-252 | Me | Me   | Ph                                 | $\text{COtBu}$            |
| 1-253 | Me | Me   | Ph                                 | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-254 | Me | Me   | Ph                                 | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-255 | Me | Me   | $\text{CF}_3$                      | H                         |
| 1-256 | Me | Me   | $\text{CF}_3$                      | $\text{COtBu}$            |
| 1-257 | Me | Me   | $\text{CF}_3$                      | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-258 | Me | Me   | $\text{CF}_3$                      | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-259 | Me | Me   | $\text{CH}_2\text{Ph}$             | H                         |
| 1-260 | Me | Me   | $\text{CH}_2\text{Ph}$             | $\text{COtBu}$            |
| 1-261 | Me | Me   | $\text{CH}_2\text{Ph}$             | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-262 | Me | Me   | $\text{CH}_2\text{Ph}$             | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-263 | Me | Me   | Ph                                 | H                         |
| 1-264 | Me | Me   | Ph                                 | $\text{COtBu}$            |
| 1-265 | Me | Me   | Ph                                 | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-266 | Me | Me   | Ph                                 | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-267 | Me | Et   | Et                                 | H                         |
| 1-268 | Me | Et   | Et                                 | $\text{COtBu}$            |
| 1-269 | Me | Et   | Et                                 | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-270 | Me | Et   | Et                                 | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-271 | Me | $-(\text{CH}_2)_5-$                                      |                                    | H                         |
| 1-272 | Me | $-(\text{CH}_2)_5-$                                      |                                    | $\text{COtBu}$            |
| 1-273 | Me | $-(\text{CH}_2)_5-$                                      |                                    | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |
| 1-274 | Me | $-(\text{CH}_2)_5-$                                      |                                    | $\text{C(S)SEt}$          |
| 1-275 | Me | $-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{Me})-(\text{CH}_2)_2-$ |                                    | H                         |
| 1-276 | Me | $-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{Me})-(\text{CH}_2)_2-$ |                                    | $\text{COtBu}$            |
| 1-277 | Me | $-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{Me})-(\text{CH}_2)_2-$ |                                    | $\text{COCH}_2\text{tBu}$ |

|       |                     |                                 |                       |
|-------|---------------------|---------------------------------|-----------------------|
| 1-278 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(Me)-(CH_2)_2-$    | C(S)SEt               |
| 1-279 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(OMe)-(CH_2)_2-$   | H                     |
| 1-280 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(OMe)-(CH_2)_2-$   | COtBu                 |
| 1-281 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(OMe)-(CH_2)_2-$   | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-282 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(OMe)-(CH_2)_2-$   | C(S)SEt               |
| 1-283 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(NMe_2)-(CH_2)_2-$ | H                     |
| 1-284 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(NMe_2)-(CH_2)_2-$ | COtBu                 |
| 1-285 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(NMe_2)-(CH_2)_2-$ | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-286 | Me                  | $-(CH_2)_2-CH(NMe_2)-(CH_2)_2-$ | C(S)SEt               |
| 1-287 | Me                  | $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$         | H                     |
| 1-288 | Me                  | $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$         | COtBu                 |
| 1-289 | Me                  | $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$         | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-290 | Me                  | $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$         | C(S)SEt               |
| 1-291 | Me                  | $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$         | H                     |
| 1-292 | Me                  | $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$         | COtBu                 |
| 1-293 | Me                  | $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$         | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-294 | Me                  | $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$         | C(S)SEt               |
| 1-295 | Me                  | $-(CH_2)_2-NMe-(CH_2)_2-$       | H                     |
| 1-296 | Me                  | $-(CH_2)_2-NMe-(CH_2)_2-$       | COtBu                 |
| 1-297 | Me                  | $-(CH_2)_2-NMe-(CH_2)_2-$       | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 1-298 | Me                  | $-(CH_2)_2-NMe-(CH_2)_2-$       | C(S)SEt               |
| 1-299 | CH <sub>2</sub> OMe | Me Et                           | H                     |
| 1-300 | CH <sub>2</sub> OMe | Me Et                           | COtBu                 |
| 1-301 | CH <sub>2</sub> OMe | Me Pr                           | H                     |
| 1-302 | CH <sub>2</sub> OMe | Me Pr                           | COtBu                 |
| 1-303 | CH <sub>2</sub> OMe | Me iPr                          | H                     |
| 1-304 | CH <sub>2</sub> OMe | Me iPr                          | COtBu                 |
| 1-305 | CH <sub>2</sub> OMe | Me cPr                          | H                     |
| 1-306 | CH <sub>2</sub> OMe | Me cPr                          | COtBu                 |

|       |                     |   |                    |       |
|-------|---------------------|---|--------------------|-------|
| 1-307 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | H     |
| 1-308 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | COtBu |
| 1-309 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CF <sub>3</sub>    | H     |
| 1-310 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CF <sub>3</sub>    | COtBu |
| 1-311 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | H     |
| 1-312 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | COtBu |
| 1-313 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | H     |
| 1-314 | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | COtBu |
| 1-315 | CH <sub>2</sub> OMe | Et  | Et                 | H     |
| 1-316 | CH <sub>2</sub> OMe | Et  | Et                 | COtBu |
| 1-317 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | H     |
| 1-318 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | COtBu |
| 1-319 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                    | H     |
| 1-320 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                    | COtBu |
| 1-321 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | H     |
| 1-322 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | COtBu |
| 1-323 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | H     |
| 1-324 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | COtBu |
| 1-325 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | H     |
| 1-326 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | COtBu |
| 1-327 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -     |                    | H     |
| 1-328 | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -     |                    | COtBu |
| 1-329 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | Et                 | H     |
| 1-330 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | Et                 | COtBu |
| 1-331 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | Pr                 | H     |
| 1-332 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | Pr                 | COtBu |
| 1-333 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | iPr                | H     |
| 1-334 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | iPr                | COtBu |
| 1-335 | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | cPr                | H     |

|       |                                     |   |                    |       |
|-------|-------------------------------------|---|--------------------|-------|
| 1-336 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | cPr                | COtBu |
| 1-337 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | Ph                 | H     |
| 1-338 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | Ph                 | COtBu |
| 1-339 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | CF <sub>3</sub>    | H     |
| 1-340 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | CF <sub>3</sub>    | COtBu |
| 1-341 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | H     |
| 1-342 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | COtBu |
| 1-343 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | Ph                 | H     |
| 1-344 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me  | Ph                 | COtBu |
| 1-345 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Et  | Et                 | H     |
| 1-346 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Et  | Et                 | COtBu |
| 1-347 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | H     |
| 1-348 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | COtBu |
| 1-349 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                    | H     |
| 1-350 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                    | COtBu |
| 1-351 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | H     |
| 1-352 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | COtBu |
| 1-353 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | H     |
| 1-354 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | COtBu |
| 1-355 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | H     |
| 1-356 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | COtBu |
| 1-357 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -     |                    | H     |
| 1-358 | CH <sub>2</sub> OEt                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -     |                    | COtBu |
| 1-359 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Et                 | H     |
| 1-360 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Et                 | COtBu |
| 1-361 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Pr                 | H     |
| 1-362 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Pr                 | COtBu |
| 1-363 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | iPr                | H     |
| 1-364 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | iPr                | COtBu |



|       |                                     |   |                    |                                    |
|-------|-------------------------------------|---|--------------------|------------------------------------|
| 1-365 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | cPr                | H                                  |
| 1-366 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | cPr                | COtBu                              |
| 1-367 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | H                                  |
| 1-368 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | COtBu                              |
| 1-369 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CF <sub>3</sub>    | H                                  |
| 1-370 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CF <sub>3</sub>    | COtBu                              |
| 1-371 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | H                                  |
| 1-372 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | COtBu                              |
| 1-373 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | H                                  |
| 1-374 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Ph                 | COtBu                              |
| 1-375 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Et  | Et                 | H                                  |
| 1-376 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Et  | Et                 | COtBu                              |
| 1-377 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | H                                  |
| 1-378 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | COtBu                              |
| 1-379 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                    | H                                  |
| 1-380 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |                    | COtBu                              |
| 1-381 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | H                                  |
| 1-382 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | COtBu                              |
| 1-383 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | H                                  |
| 1-384 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | COtBu                              |
| 1-385 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | H                                  |
| 1-386 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | COtBu                              |
| 1-387 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -     |                    | H                                  |
| 1-388 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -     |                    | COtBu                              |
| 1-389 | CH <sub>2</sub> OMe                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | COcPr                              |
| 1-390 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me  | Me                 | COcPr                              |
| 1-391 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me  | Me                 | COcPr(1-Me)                        |
| 1-392 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me  | Me                 | COcPr(2-Me)                        |
| 1-393 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me  | Me                 | COcPr(1-Me, 2, 2-Cl <sub>2</sub> ) |

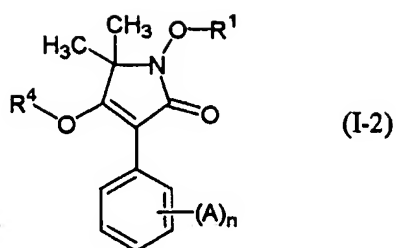
|       |                     |    |    |  |
|-------|---------------------|----|----|--|
| 1-394 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcPr (1-CN)                                 |
| 1-395 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcBu  |
| 1-396 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcPent                                      |
| 1-397 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCCl=CH <sub>2</sub>                        |
| 1-398 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-Cl-Ph)                                 |
| 1-399 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-Me-Ph)                                 |
| 1-400 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-OMe-Ph)                                |
| 1-401 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (3-OMe-Ph)                                |
| 1-402 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (4-OMe-Ph)                                |
| 1-403 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-CF <sub>3</sub> -Ph)                   |
| 1-404 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2, 6- (OMe) <sub>2</sub> -Ph)            |
| 1-405 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-OMe, 3-Me-Ph)                          |
| 1-406 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-OMe, 4-Me-Ph)                          |
| 1-407 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (3, 4, 5- (OMe) <sub>3</sub> -Ph)         |
| 1-408 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (5-Me-6-Chr)                              |
| 1-409 | CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (5-Q <sup>1</sup> )                       |
| 1-410 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | COcPr  |
| 1-411 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | COcPr (1-Me)                                 |
| 1-412 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | COcPr (1-CN)                                 |
| 1-413 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | COcPr (1- (4-OEt-Ph), 2, 2-Cl <sub>2</sub> ) |
| 1-414 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | COcBu  |
| 1-415 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | COCCl=CH <sub>2</sub>                        |
| 1-416 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (2-Me-Ph)                                 |
| 1-417 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (2-OMe-Ph)                                |
| 1-418 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (2-Cl-Ph)                                 |
| 1-419 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (3-OMe-Ph)                                |
| 1-420 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (2-SMe-Ph)                                |
| 1-421 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (3-Me-Ph)                                 |
| 1-422 | CH <sub>2</sub> OEt | Me | Me | CO (3-CF <sub>3</sub> -Ph)                   |

|       |                                     |    |    |  |
|-------|-------------------------------------|----|----|--|
| 1-423 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (3-CN-Ph)                               |
| 1-424 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (3-Cl-Ph)                               |
| 1-425 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (4-OMe-Ph)                              |
| 1-426 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (4-Me-Ph)                               |
| 1-427 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (3-Cl-Ph)                               |
| 1-428 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (2-CF <sub>3</sub> -Ph)                 |
| 1-429 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (2-OPh-Ph)                              |
| 1-430 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (2-OEt-Ph)                              |
| 1-431 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (2-OPr-Ph)                              |
| 1-432 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (3-Pyr)                                 |
| 1-433 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (4-CF <sub>3</sub> -3-Pyr)              |
| 1-434 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (2-SMe, 4-CF <sub>3</sub> -5-Pym)       |
| 1-435 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (1-Me, 3-CF <sub>3</sub> , 5-Cl-4-Pyza) |
| 1-436 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (4-Me-5-Q <sup>2</sup> )                |
| 1-437 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CONMe <sub>2</sub>                         |
| 1-438 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CO (N-Mor)                                 |
| 1-439 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)                 |
| 1-440 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcPr                                      |
| 1-441 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcPr (1-Me)                               |
| 1-442 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcPr (1-CN)                               |
| 1-443 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COcBu                                      |
| 1-444 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | COCCl=CH <sub>2</sub>                      |
| 1-445 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-Me-Ph)                               |
| 1-446 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-SMe-Ph)                              |
| 1-447 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-OMe-Ph)                              |
| 1-448 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-Br-Ph)                               |
| 1-449 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-NO <sub>2</sub> -Ph)                 |
| 1-450 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-CF <sub>3</sub> -Ph)                 |
| 1-451 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | CO (2-S (O) Me-Ph)                         |

|       |                                     |                                    |  |   |
|-------|-------------------------------------|------------------------------------|--|---|
| 1-452 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-SO <sub>2</sub> Me-Ph)               |
| 1-453 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-CH <sub>2</sub> OPh-Ph)              |
| 1-454 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-CO <sub>2</sub> Me-Ph)               |
| 1-455 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-OPh-Ph)                              |
| 1-456 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-OEt-Ph)                              |
| 1-457 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-OPr-Ph)                              |
| 1-458 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-OAc-Ph)                              |
| 1-459 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-Me-3-Pyr)                            |
| 1-460 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(4-CF <sub>3</sub> -3-Pyr)              |
| 1-461 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(2-SMe, 4-CF <sub>3</sub> -5-Pym)       |
| 1-462 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(1-Me, 3-CF <sub>3</sub> , 5-Cl-4-Pyza) |
| 1-463 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CO(4-Me-5-Q <sup>2</sup> )                |
| 1-464 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CH <sub>2</sub> Ph                        |
| 1-465 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)                |
| 1-466 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me                                 | Me   | CH <sub>2</sub> OEt                       |
| 1-467 | Me                                  | Me                                 | Me   | COcPr                                     |
| 1-468 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                                   | H   |
| 1-469 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                                   | COcPr                                     |
| 1-470 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | CH <sub>2</sub> cHex   | H   |
| 1-471 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph                                   | H   |
| 1-472 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                   | H   |
| 1-473 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                  | H   |
| 1-474 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me                                 | (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | H   |
| 1-475 | CH <sub>2</sub> OMe                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - |  | H   |

表 2

85



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>     | R <sup>1</sup>                      | R <sup>4</sup> |
|-------|----------------------|-------------------------------------|----------------|
| 2-1   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | H                                   | COtBu          |
| 2-2   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | H              |
| 2-3   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu          |
| 2-4   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt        |
| 2-5   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H              |
| 2-6   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu          |
| 2-7   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt        |
| 2-8   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H              |
| 2-9   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu          |
| 2-10  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt        |
| 2-11  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H              |
| 2-12  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu          |
| 2-13  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt        |
| 2-14  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H              |
| 2-15  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu          |
| 2-16  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt        |
| 2-17  | 2-Cl, 4-Me           | H                                   | COtBu          |
| 2-18  | 2-Cl, 4-Me           | Me                                  | H              |
| 2-19  | 2-Cl, 4-Me           | Me                                  | COtBu          |
| 2-20  | 2-Cl, 4-Me           | Me                                  | C(S)SEt        |
| 2-21  | 2-Cl, 4-Me           | Et                                  | H              |
| 2-22  | 2-Cl, 4-Me           | Et                                  | COtBu          |
| 2-23  | 2-Cl, 4-Me           | Et                                  | C(S)SEt        |

|      |                             |                                     |         |
|------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-24 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-25 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-26 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-27 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-28 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-29 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-30 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-31 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-32 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-33 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | H                                   | COtBu   |
| 2-34 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | H       |
| 2-35 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | COtBu   |
| 2-36 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-37 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | H       |
| 2-38 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | COtBu   |
| 2-39 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-40 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-41 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-42 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-43 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-44 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-45 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-46 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-47 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-48 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-49 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | H                                   | COtBu   |
| 2-50 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | H       |
| 2-51 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | COtBu   |
| 2-52 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | C(S)SEt |

|      |                      |                                     |         |
|------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-53 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 2-54 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-55 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-56 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-57 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-58 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-59 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-60 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-61 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-62 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-63 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-64 | 2, 3-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-65 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-66 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 2-67 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-68 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-69 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 2-70 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-71 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-72 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-73 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-74 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-75 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-76 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-77 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-78 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-79 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-80 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-81 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-82  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 2-83  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-84  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-85  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 2-86  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-87  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-88  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-89  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-90  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-91  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-92  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-93  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-94  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-95  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-96  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-97  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-98  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 2-99  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-100 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-101 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 2-102 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-103 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-104 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-105 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-106 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-107 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-108 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-109 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-110 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |



|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-111 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-112 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-113 | 2-Me, 4-Br           | H                                   | COtBu   |
| 2-114 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | H       |
| 2-115 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | COtBu   |
| 2-116 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-117 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | H       |
| 2-118 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | COtBu   |
| 2-119 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-120 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-121 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-122 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-123 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-124 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-125 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-126 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-127 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-128 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-129 | 2-Me, 6-Cl           | H                                   | COtBu   |
| 2-130 | 2-Me, 6-Cl           | Me                                  | H       |
| 2-131 | 2-Me, 6-Cl           | Me                                  | COtBu   |
| 2-132 | 2-Me, 6-Cl           | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-133 | 2-Me, 6-Cl           | Et                                  | H       |
| 2-134 | 2-Me, 6-Cl           | Et                                  | COtBu   |
| 2-135 | 2-Me, 6-Cl           | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-136 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-137 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-138 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-139 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |

|       |             |                                     |         |
|-------|-------------|-------------------------------------|---------|
| 2-140 | 2-Me, 6-Cl  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-141 | 2-Me, 6-Cl  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-142 | 2-Me, 6-Cl  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-143 | 2-Me, 6-Cl  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-144 | 2-Me, 6-Cl  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-145 | 2-Me, 6-Br  | H                                   | COtBu   |
| 2-146 | 2-Me, 6-Br  | Me                                  | H       |
| 2-147 | 2-Me, 6-Br  | Me                                  | COtBu   |
| 2-148 | 2-Me, 6-Br  | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-149 | 2-Me, 6-Br  | Et                                  | H       |
| 2-150 | 2-Me, 6-Br  | Et                                  | COtBu   |
| 2-151 | 2-Me, 6-Br  | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-152 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-153 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-154 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-155 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-156 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-157 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-158 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-159 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-160 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-161 | 2-Me, 4-OMe | H                                   | COtBu   |
| 2-162 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | H       |
| 2-163 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | COtBu   |
| 2-164 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-165 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | H       |
| 2-166 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | COtBu   |
| 2-167 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-168 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |

|       |                             |                                     |         |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-169 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-170 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-171 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-172 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-173 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-174 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-175 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-176 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-177 | 2-Me, 4-Ph                  | H                                   | COtBu   |
| 2-178 | 2-Me, 4-Ph                  | Me                                  | H       |
| 2-179 | 2-Me, 4-Ph                  | Me                                  | COtBu   |
| 2-180 | 2-Me, 4-Ph                  | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-181 | 2-Me, 4-Ph                  | Et                                  | H       |
| 2-182 | 2-Me, 4-Ph                  | Et                                  | COtBu   |
| 2-183 | 2-Me, 4-Ph                  | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-184 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-185 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-186 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-187 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-188 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-189 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-190 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-191 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-192 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-193 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | H                                   | COtBu   |
| 2-194 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | H       |
| 2-195 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | COtBu   |
| 2-196 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-197 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | H       |

|       |                             |                                     |         |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-198 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | COtBu   |
| 2-199 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-200 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-201 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-202 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-203 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-204 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-205 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-206 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-207 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-208 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-209 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | H                                   | COtBu   |
| 2-210 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | H       |
| 2-211 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | COtBu   |
| 2-212 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-213 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | H       |
| 2-214 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | COtBu   |
| 2-215 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-216 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-217 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-218 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-219 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-220 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-221 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-222 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-223 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-224 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-225 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | H                                   | COtBu   |
| 2-226 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | H       |

|       |                            |                                     |         |
|-------|----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-227 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | Me                                  | COtBu   |
| 2-228 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-229 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | Et                                  | H       |
| 2-230 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | Et                                  | COtBu   |
| 2-231 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-232 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-233 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-234 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-235 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-236 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-237 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-238 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-239 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-240 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-241 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-242 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | Me                                  | H       |
| 2-243 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-244 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-245 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | Et                                  | H       |
| 2-246 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-247 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-248 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-249 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-250 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-251 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-252 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-253 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-254 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-255 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |

|       |                                |                                     |                       |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|-----------------------|
| 2-256 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt               |
| 2-257 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | H                                   | C0tBu                 |
| 2-258 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | H                     |
| 2-259 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | C0tBu                 |
| 2-260 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | C(S)SEt               |
| 2-261 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | H                     |
| 2-262 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | C0tBu                 |
| 2-263 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | C(S)SEt               |
| 2-264 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H                     |
| 2-265 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | C0tBu                 |
| 2-266 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt               |
| 2-267 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H                     |
| 2-268 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | C0tBu                 |
| 2-269 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt               |
| 2-270 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                     |
| 2-271 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C0tBu                 |
| 2-272 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt               |
| 2-273 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | C0tBu                 |
| 2-274 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | H                     |
| 2-275 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | C0tBu                 |
| 2-276 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | C(S)SEt               |
| 2-277 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | H                     |
| 2-278 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | C0tBu                 |
| 2-279 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 2-280 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | C(S)SEt               |
| 2-281 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H                     |
| 2-282 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C0tBu                 |
| 2-283 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt               |
| 2-284 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H                     |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-285 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-286 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-287 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-288 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-289 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-290 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-291 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 2-292 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-293 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-294 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 2-295 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-296 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-297 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-298 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-299 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-300 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-301 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-302 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-303 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-304 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-305 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-306 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-307 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 2-308 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-309 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-310 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 2-311 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-312 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-313 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-314 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-315 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-316 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-317 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-318 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-319 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-320 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-321 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-322 | 2-Cl, 6-Br           | H                                   | COtBu   |
| 2-323 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | H       |
| 2-324 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | COtBu   |
| 2-325 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-326 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | H       |
| 2-327 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | COtBu   |
| 2-328 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-329 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-330 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-331 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-332 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-333 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-334 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-335 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-336 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-337 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-338 | 2-Br                 | H                                   | COtBu   |
| 2-339 | 2-Br                 | Me                                  | H       |
| 2-340 | 2-Br                 | Me                                  | COtBu   |
| 2-341 | 2-Br                 | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-342 | 2-Br                 | Et                                  | H       |



|       |  |                                     |         |
|-------|--|-------------------------------------|---------|
| 2-343 | 2-Br                                     | Et                                  | COtBu   |
| 2-344 | 2-Br                                     | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-345 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-346 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-347 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-348 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-349 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-350 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-351 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-352 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-353 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-354 | 2-Br, 4-Me                               | H                                   | COtBu   |
| 2-355 | 2-Br, 4-Me                               | Me                                  | H       |
| 2-356 | 2-Br, 4-Me                               | Me                                  | COtBu   |
| 2-357 | 2-Br, 4-Me                               | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-358 | 2-Br, 4-Me                               | Et                                  | H       |
| 2-359 | 2-Br, 4-Me                               | Et                                  | COtBu   |
| 2-360 | 2-Br, 4-Me                               | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-361 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-362 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-363 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-364 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-365 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-366 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-367 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-368 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-369 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-370 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-371 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | H       |

|       |  |                                     |         |
|-------|--|-------------------------------------|---------|
| 2-372 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-373 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-374 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 2-375 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-376 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-377 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-378 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-379 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-380 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-381 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-382 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-383 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-384 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-385 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-386 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | H                                   | COtBu   |
| 2-387 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | Me                                  | H       |
| 2-388 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | Me                                  | COtBu   |
| 2-389 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-390 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | Et                                  | H       |
| 2-391 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | Et                                  | COtBu   |
| 2-392 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-393 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-394 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-395 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-396 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-397 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-398 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-399 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-400 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |

|       |                         |                                     |         |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-401 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-402 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-403 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | H       |
| 2-404 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-405 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-406 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 2-407 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 2-408 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-409 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-410 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-411 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-412 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-413 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-414 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-415 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-416 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-417 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-418 | 2-Cl                    | H                                   | COtBu   |
| 2-419 | 2-Cl                    | Me                                  | H       |
| 2-420 | 2-Cl                    | Me                                  | COtBu   |
| 2-421 | 2-Cl                    | Me                                  | C(S)SEt |
| 2-422 | 2-Cl                    | Et                                  | H       |
| 2-423 | 2-Cl                    | Et                                  | COtBu   |
| 2-424 | 2-Cl                    | Et                                  | C(S)SEt |
| 2-425 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-426 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-427 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 2-428 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-429 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |

|       |                         |                                     |         |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|---------|
| 2-430 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 2-431 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-432 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-433 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 2-434 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 2-435 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | H       |
| 2-436 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 2-437 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-438 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-439 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-440 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-441 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-442 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-443 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | H                                   | COtBu   |
| 2-444 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | Me                                  | H       |
| 2-445 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | Me                                  | COtBu   |
| 2-446 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-447 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-448 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-449 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 2-450 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 2-451 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 2-452 | 2-Br, 5-Me              | H                                   | COtBu   |
| 2-453 | 2-Br, 5-Me              | Me                                  | H       |
| 2-454 | 2-Br, 5-Me              | Me                                  | COtBu   |
| 2-455 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 2-456 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 2-457 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 2-458 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |

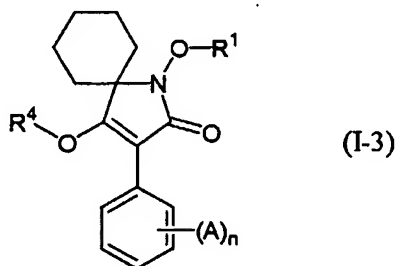
|       |                             |                                     |       |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|-------|
| 2-459 | 2-Br, 5-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-460 | 2-Br, 5-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-461 | 2-Me, 5-Br                  | H                                   | COtBu |
| 2-462 | 2-Me, 5-Br                  | Me                                  | H     |
| 2-463 | 2-Me, 5-Br                  | Me                                  | COtBu |
| 2-464 | 2-Me, 5-Br                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-465 | 2-Me, 5-Br                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-466 | 2-Me, 5-Br                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-467 | 2-Me, 5-Br                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-468 | 2-Me, 5-Br                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-469 | 2-Me, 5-Br                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-470 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | H                                   | COtBu |
| 2-471 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | H     |
| 2-472 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | COtBu |
| 2-473 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-474 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-475 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-476 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-477 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-478 | 3, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-479 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-480 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-481 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-482 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-483 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-484 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-485 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-486 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-487 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |

|       |                                |                                     |       |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|-------|
| 2-488 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-489 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-490 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-491 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-492 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-493 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-494 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-495 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-496 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-497 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-498 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-499 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-500 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-501 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-502 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-503 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-504 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-505 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-506 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-507 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-508 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-509 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-510 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 2-511 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 2-512 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 2-513 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-514 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-515 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 2-516 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |

|       |                              |  |       |
|-------|------------------------------|--|-------|
| 2-517 | 2-Me, 6-iPr                  | CH <sub>2</sub> OEt                                  | H     |
| 2-518 | 2-Me, 6-iPr                  | CH <sub>2</sub> OEt                                  | COtBu |
| 2-519 | 2-Me, 6-iPr                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | H     |
| 2-520 | 2-Me, 6-iPr                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | COtBu |
| 2-521 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-522 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> OMe                                  | COtBu |
| 2-523 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> OEt                                  | H     |
| 2-524 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> OEt                                  | COtBu |
| 2-525 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | H     |
| 2-526 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>      | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | COtBu |
| 2-527 | 2-Br, 5-Cl                   | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-528 | 2-Cl, 6-F                    | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-529 | 2-Cl, 6-F                    | CH <sub>2</sub> OMe                                  | COtBu |
| 2-530 | 2-Cl, 6-F                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | H     |
| 2-531 | 2-Cl, 6-F                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | COtBu |
| 2-532 | 2-Cl, 6-F                    | CH <sub>2</sub> OEt                                  | H     |
| 2-533 | 2-Cl, 6-F                    | CH <sub>2</sub> OEt                                  | COtBu |
| 2-534 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>      | CH <sub>2</sub> OMe                                  | COcPr |
| 2-535 | 2-Me, 6-Et                   | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-536 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>   | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-537 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>   | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 2-538 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-tBu | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-539 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-540 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                                  | H     |
| 2-541 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-OPh | CH <sub>2</sub> OMe                                  | H     |
| 2-542 | 2, 6-Me <sub>2</sub>         | Pr   | H     |
| 2-543 | 2, 6-Me <sub>2</sub>         | iPr  | H     |
| 2-544 | 2, 6-Me <sub>2</sub>         | CH <sub>2</sub> cPr                                  | H     |
| 2-545 | 2, 6-Me <sub>2</sub>         | CH <sub>2</sub> C≡CH                                 | H     |

|       |                      |  |       |
|-------|----------------------|--|-------|
| 2-546 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> SMe                                  | H     |
| 2-547 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> SMe                                  | COtBu |
| 2-548 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | H     |
| 2-549 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt                  | COtBu |
| 2-550 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | H     |
| 2-551 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe  | COtBu |
| 2-552 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | H     |
| 2-553 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | COtBu |
| 2-554 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe  | H     |
| 2-555 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe                            | H     |
| 2-556 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> (3-Thf)                              | H     |
| 2-557 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | 3-Thf  | H     |

表 3



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>     | R <sup>1</sup>      | R <sup>4</sup> |
|-------|----------------------|---------------------|----------------|
| 3-1   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | H                   | COtBu          |
| 3-2   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                  | H              |
| 3-3   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                  | COtBu          |
| 3-4   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                  | C(S)SEt        |
| 3-5   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                  | H              |
| 3-6   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                  | COtBu          |
| 3-7   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                  | C(S)SEt        |
| 3-8   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | H              |



|      |                             |                                     |         |
|------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-9  | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-10 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-11 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-12 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-13 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-14 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-15 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-16 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-17 | 2-Cl, 4-Me                  | H                                   | COtBu   |
| 3-18 | 2-Cl, 4-Me                  | Me                                  | H       |
| 3-19 | 2-Cl, 4-Me                  | Me                                  | COtBu   |
| 3-20 | 2-Cl, 4-Me                  | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-21 | 2-Cl, 4-Me                  | Et                                  | H       |
| 3-22 | 2-Cl, 4-Me                  | Et                                  | COtBu   |
| 3-23 | 2-Cl, 4-Me                  | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-24 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-25 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-26 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-27 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-28 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-29 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-30 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-31 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-32 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-33 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | H                                   | COtBu   |
| 3-34 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | H       |
| 3-35 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | COtBu   |
| 3-36 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-37 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | H       |

|      |                             |                                     |         |
|------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-38 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | COtBu   |
| 3-39 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-40 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-41 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-42 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-43 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-44 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-45 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-46 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-47 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-48 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-49 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | H                                   | COtBu   |
| 3-50 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | H       |
| 3-51 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | COtBu   |
| 3-52 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-53 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | H       |
| 3-54 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | COtBu   |
| 3-55 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-56 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-57 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-58 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-59 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-60 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-61 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-62 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-63 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-64 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-65 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | H                                   | COtBu   |
| 3-66 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | H       |

|      |                      |                                     |         |
|------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-67 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-68 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-69 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 3-70 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-71 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-72 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-73 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-74 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-75 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-76 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-77 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-78 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-79 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-80 | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-81 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-82 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 3-83 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-84 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-85 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 3-86 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-87 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-88 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-89 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-90 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-91 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-92 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-93 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-94 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-95 | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-96  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-97  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-98  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 3-99  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-100 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-101 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 3-102 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-103 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-104 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-105 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-106 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-107 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-108 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-109 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-110 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-111 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-112 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-113 | 2-Me, 4-Br           | H                                   | COtBu   |
| 3-114 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | H       |
| 3-115 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | COtBu   |
| 3-116 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-117 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | H       |
| 3-118 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | COtBu   |
| 3-119 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-120 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-121 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-122 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-123 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-124 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |

|       |            |                                     |         |
|-------|------------|-------------------------------------|---------|
| 3-125 | 2-Me, 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-126 | 2-Me, 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-127 | 2-Me, 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-128 | 2-Me, 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-129 | 2-Me, 6-Cl | H                                   | COtBu   |
| 3-130 | 2-Me, 6-Cl | Me                                  | H       |
| 3-131 | 2-Me, 6-Cl | Me                                  | COtBu   |
| 3-132 | 2-Me, 6-Cl | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-133 | 2-Me, 6-Cl | Et                                  | H       |
| 3-134 | 2-Me, 6-Cl | Et                                  | COtBu   |
| 3-135 | 2-Me, 6-Cl | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-136 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-137 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-138 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-139 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-140 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-141 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-142 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-143 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-144 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-145 | 2-Me, 6-Br | H                                   | COtBu   |
| 3-146 | 2-Me, 6-Br | Me                                  | H       |
| 3-147 | 2-Me, 6-Br | Me                                  | COtBu   |
| 3-148 | 2-Me, 6-Br | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-149 | 2-Me, 6-Br | Et                                  | H       |
| 3-150 | 2-Me, 6-Br | Et                                  | COtBu   |
| 3-151 | 2-Me, 6-Br | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-152 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-153 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |

|       |             |                                     |         |
|-------|-------------|-------------------------------------|---------|
| 3-154 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-155 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-156 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-157 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-158 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-159 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-160 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-161 | 2-Me, 4-OMe | H                                   | COtBu   |
| 3-162 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | H       |
| 3-163 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | COtBu   |
| 3-164 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-165 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | H       |
| 3-166 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | COtBu   |
| 3-167 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-168 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-169 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-170 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-171 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-172 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-173 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-174 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-175 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-176 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-177 | 2-Me, 4-Ph  | H                                   | COtBu   |
| 3-178 | 2-Me, 4-Ph  | Me                                  | H       |
| 3-179 | 2-Me, 4-Ph  | Me                                  | COtBu   |
| 3-180 | 2-Me, 4-Ph  | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-181 | 2-Me, 4-Ph  | Et                                  | H       |
| 3-182 | 2-Me, 4-Ph  | Et                                  | COtBu   |

|       |                             |                                     |         |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-183 | 2-Me, 4-Ph                  | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-184 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-185 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-186 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-187 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-188 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-189 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-190 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-191 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-192 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-193 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | H                                   | COtBu   |
| 3-194 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | H       |
| 3-195 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | COtBu   |
| 3-196 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-197 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | H       |
| 3-198 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | COtBu   |
| 3-199 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-200 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-201 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-202 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-203 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-204 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-205 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-206 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-207 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-208 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-209 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | H                                   | COtBu   |
| 3-210 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | H       |
| 3-211 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | COtBu   |

|       |                             |                                     |         |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-212 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-213 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | H       |
| 3-214 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | COtBu   |
| 3-215 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-216 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-217 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-218 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-219 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-220 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-221 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-222 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-223 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-224 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-225 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | H                                   | COtBu   |
| 3-226 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | H       |
| 3-227 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | COtBu   |
| 3-228 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-229 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Et                                  | H       |
| 3-230 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Et                                  | COtBu   |
| 3-231 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-232 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-233 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-234 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-235 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-236 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-237 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-238 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-239 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-240 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |



|       |                                |                                     |         |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-241 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | H                                   | COtBu   |
| 3-242 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Me                                  | H       |
| 3-243 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Me                                  | COtBu   |
| 3-244 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-245 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Et                                  | H       |
| 3-246 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Et                                  | COtBu   |
| 3-247 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-248 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-249 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-250 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-251 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-252 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-253 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-254 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-255 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-256 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-257 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | H                                   | COtBu   |
| 3-258 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | H       |
| 3-259 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | COtBu   |
| 3-260 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-261 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | H       |
| 3-262 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | COtBu   |
| 3-263 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-264 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-265 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-266 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-267 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-268 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-269 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |

|       |                                |                                     |                       |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|-----------------------|
| 3-270 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                     |
| 3-271 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu                 |
| 3-272 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt               |
| 3-273 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | COtBu                 |
| 3-274 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | H                     |
| 3-275 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | COtBu                 |
| 3-276 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | C(S)SEt               |
| 3-277 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | H                     |
| 3-278 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | COtBu                 |
| 3-279 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 3-280 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | C(S)SEt               |
| 3-281 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H                     |
| 3-282 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu                 |
| 3-283 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt               |
| 3-284 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H                     |
| 3-285 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu                 |
| 3-286 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt               |
| 3-287 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                     |
| 3-288 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu                 |
| 3-289 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt               |
| 3-290 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | COtBu                 |
| 3-291 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | H                     |
| 3-292 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | COtBu                 |
| 3-293 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | C(S)SEt               |
| 3-294 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | H                     |
| 3-295 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | COtBu                 |
| 3-296 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Et                                  | C(S)SEt               |
| 3-297 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H                     |
| 3-298 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu                 |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-299 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-300 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-301 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-302 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-303 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-304 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-305 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-306 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-307 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 3-308 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-309 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-310 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 3-311 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-312 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-313 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-314 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-315 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-316 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-317 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-318 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-319 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-320 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-321 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-322 | 2-Cl, 6-Br           | H                                   | COtBu   |
| 3-323 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | H       |
| 3-324 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | COtBu   |
| 3-325 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-326 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | H       |
| 3-327 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | COtBu   |

|       |            |                                     |         |
|-------|------------|-------------------------------------|---------|
| 3-328 | 2-Cl, 6-Br | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-329 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-330 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-331 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-332 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-333 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-334 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-335 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-336 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-337 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-338 | 2-Br       | H                                   | COtBu   |
| 3-339 | 2-Br       | Me                                  | H       |
| 3-340 | 2-Br       | Me                                  | COtBu   |
| 3-341 | 2-Br       | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-342 | 2-Br       | Et                                  | H       |
| 3-343 | 2-Br       | Et                                  | COtBu   |
| 3-344 | 2-Br       | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-345 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-346 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-347 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-348 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-349 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-350 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-351 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-352 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-353 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-354 | 2-Br, 4-Me | H                                   | COtBu   |
| 3-355 | 2-Br, 4-Me | Me                                  | H       |
| 3-356 | 2-Br, 4-Me | Me                                  | COtBu   |

|       |  |                                     |         |
|-------|--|-------------------------------------|---------|
| 3-357 | 2-Br, 4-Me                               | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-358 | 2-Br, 4-Me                               | Et                                  | H       |
| 3-359 | 2-Br, 4-Me                               | Et                                  | COtBu   |
| 3-360 | 2-Br, 4-Me                               | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-361 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-362 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-363 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-364 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-365 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-366 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-367 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-368 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-369 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-370 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-371 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | H       |
| 3-372 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-373 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-374 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 3-375 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-376 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-377 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-378 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-379 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-380 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-381 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-382 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-383 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-384 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-385 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |

|       |                         |                                     |         |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-386 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-387 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 3-388 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-389 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-392 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-395 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-396 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-397 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-398 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-399 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-400 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | H       |
| 3-401 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-402 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-403 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 3-404 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-405 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-406 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-407 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-408 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-409 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-410 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-411 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-412 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-413 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-414 | 2, 4, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-415 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 3-416 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | H       |
| 3-417 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 3-418 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Me                                  | C(S)SEt |

|       |                         |                                     |         |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|---------|
| 3-419 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 3-420 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 3-421 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-422 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-423 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-424 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-425 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-426 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-427 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-428 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-429 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-430 | 2, 3, 6-Cl <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-431 | 2-Cl                    | H                                   | COtBu   |
| 3-432 | 2-Cl                    | Me                                  | H       |
| 3-433 | 2-Cl                    | Me                                  | COtBu   |
| 3-434 | 2-Cl                    | Me                                  | C(S)SEt |
| 3-435 | 2-Cl                    | Et                                  | H       |
| 3-436 | 2-Cl                    | Et                                  | COtBu   |
| 3-437 | 2-Cl                    | Et                                  | C(S)SEt |
| 3-438 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 3-439 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 3-440 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 3-441 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 3-442 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 3-443 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 3-444 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 3-445 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 3-446 | 2-Cl                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 3-447 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |

|       |                         |                                     |       |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|-------|
| 3-448 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | H     |
| 3-449 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu |
| 3-450 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-451 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-452 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-453 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-454 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-455 | 2-Cl, 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-456 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | H                                   | COtBu |
| 3-457 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | Me                                  | H     |
| 3-458 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | Me                                  | COtBu |
| 3-459 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-460 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-461 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-462 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-463 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-464 | 2, 5-Br <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-465 | 2-Br, 5-Me              | H                                   | COtBu |
| 3-466 | 2-Br, 5-Me              | Me                                  | H     |
| 3-467 | 2-Br, 5-Me              | Me                                  | COtBu |
| 3-468 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-469 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-470 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-471 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-472 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-473 | 2-Br, 5-Me              | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-474 | 2-Me, 5-Br              | H                                   | COtBu |
| 3-475 | 2-Me, 5-Br              | Me                                  | H     |
| 3-476 | 2-Me, 5-Br              | Me                                  | COtBu |

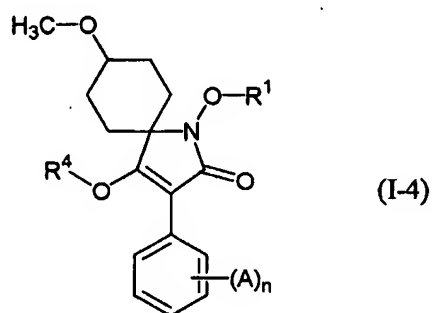


|       |                                |                                     |       |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|-------|
| 3-477 | 2-Me, 5-Br                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-478 | 2-Me, 5-Br                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-479 | 2-Me, 5-Br                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-480 | 2-Me, 5-Br                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-481 | 2-Me, 5-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-482 | 2-Me, 5-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-483 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | H                                   | COtBu |
| 3-484 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | Me                                  | H     |
| 3-485 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | Me                                  | COtBu |
| 3-486 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-487 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-488 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-489 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-490 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-491 | 3, 5-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-492 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-493 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-494 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-495 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-496 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-497 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 3-Cl    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-498 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-499 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-500 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-501 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-502 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-503 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Cl    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-504 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-505 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |

|       |                                |                                     |       |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|-------|
| 3-506 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-507 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-508 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-509 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-510 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-511 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-512 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-513 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-514 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-515 | 2-Cl, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-516 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-517 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-518 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-519 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-520 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-521 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-522 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-523 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-524 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-525 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-526 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-527 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-528 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |
| 3-529 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-530 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-531 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-532 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-533 | 2-Me, 6-iPr                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-534 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | H     |

|       |                         |                                     |       |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|-------|
| 3-535 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu |
| 3-536 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H     |
| 3-537 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu |
| 3-538 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H     |
| 3-539 | 2, 6-(iPr) <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu |
| 3-540 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr |

表 4



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>     | R <sup>1</sup>      | R <sup>4</sup> |
|-------|----------------------|---------------------|----------------|
| 4-1   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | H                   | COtBu          |
| 4-2   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                  | H              |
| 4-3   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                  | COtBu          |
| 4-4   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me                  | C(S)SEt        |
| 4-5   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                  | H              |
| 4-6   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                  | COtBu          |
| 4-7   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et                  | C(S)SEt        |
| 4-8   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | H              |
| 4-9   | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | COtBu          |
| 4-10  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt        |
| 4-11  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | H              |
| 4-12  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | COtBu          |
| 4-13  | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | C(S)SEt        |

|      |                             |                                     |         |
|------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-14 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-15 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-16 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-17 | 2-Cl, 4-Me                  | H                                   | COtBu   |
| 4-18 | 2-Cl, 4-Me                  | Me                                  | H       |
| 4-19 | 2-Cl, 4-Me                  | Me                                  | COtBu   |
| 4-20 | 2-Cl, 4-Me                  | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-21 | 2-Cl, 4-Me                  | Et                                  | H       |
| 4-22 | 2-Cl, 4-Me                  | Et                                  | COtBu   |
| 4-23 | 2-Cl, 4-Me                  | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-24 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-25 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-26 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-27 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-28 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-29 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-30 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-31 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-32 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-33 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | H                                   | COtBu   |
| 4-34 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | H       |
| 4-35 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | COtBu   |
| 4-36 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-37 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | H       |
| 4-38 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | COtBu   |
| 4-39 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-40 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-41 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-42 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |

|      |                             |                                     |         |
|------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-43 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-44 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-45 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-46 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-47 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-48 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-49 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | H                                   | COtBu   |
| 4-50 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | H       |
| 4-51 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | COtBu   |
| 4-52 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-53 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | H       |
| 4-54 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | COtBu   |
| 4-55 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-56 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-57 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-58 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-59 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-60 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-61 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-62 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-63 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-64 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-65 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | H                                   | COtBu   |
| 4-66 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | H       |
| 4-67 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | COtBu   |
| 4-68 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-69 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | H       |
| 4-70 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | COtBu   |
| 4-71 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Et                                  | C(S)SEt |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-72  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-73  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-74  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-75  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-76  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-77  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-78  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-79  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-80  | 2, 4-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-81  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 4-82  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 4-83  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 4-84  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-85  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 4-86  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 4-87  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-88  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-89  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-90  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-91  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-92  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-93  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-94  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-95  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-96  | 2, 5-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-97  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 4-98  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 4-99  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 4-100 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-101 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 4-102 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 4-103 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-104 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-105 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-106 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-107 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-108 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-109 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-110 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-111 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-112 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-113 | 2-Me, 4-Br           | H                                   | COtBu   |
| 4-114 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | H       |
| 4-115 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | COtBu   |
| 4-116 | 2-Me, 4-Br           | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-117 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | H       |
| 4-118 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | COtBu   |
| 4-119 | 2-Me, 4-Br           | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-120 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-121 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-122 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-123 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-124 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-125 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-126 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-127 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-128 | 2-Me, 4-Br           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-129 | 2-Me, 6-Cl           | H                                   | COtBu   |

|       |            |                                     |         |
|-------|------------|-------------------------------------|---------|
| 4-130 | 2-Me, 6-Cl | Me                                  | H       |
| 4-131 | 2-Me, 6-Cl | Me                                  | COtBu   |
| 4-132 | 2-Me, 6-Cl | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-133 | 2-Me, 6-Cl | Et                                  | H       |
| 4-134 | 2-Me, 6-Cl | Et                                  | COtBu   |
| 4-135 | 2-Me, 6-Cl | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-136 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-137 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-138 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-139 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-140 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-141 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-142 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-143 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-144 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-145 | 2-Me, 6-Br | H                                   | COtBu   |
| 4-146 | 2-Me, 6-Br | Me                                  | H       |
| 4-147 | 2-Me, 6-Br | Me                                  | COtBu   |
| 4-148 | 2-Me, 6-Br | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-149 | 2-Me, 6-Br | Et                                  | H       |
| 4-150 | 2-Me, 6-Br | Et                                  | COtBu   |
| 4-151 | 2-Me, 6-Br | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-152 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-153 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-154 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-155 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-156 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-157 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-158 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |



|       |             |                                     |         |
|-------|-------------|-------------------------------------|---------|
| 4-159 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-160 | 2-Me, 6-Br  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-161 | 2-Me, 4-OMe | H                                   | COtBu   |
| 4-162 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | H       |
| 4-163 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | COtBu   |
| 4-164 | 2-Me, 4-OMe | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-165 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | H       |
| 4-166 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | COtBu   |
| 4-167 | 2-Me, 4-OMe | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-168 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-169 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-170 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-171 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-172 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-173 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-174 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-175 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-176 | 2-Me, 4-OMe | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-177 | 2-Me, 4-Ph  | H                                   | COtBu   |
| 4-178 | 2-Me, 4-Ph  | Me                                  | H       |
| 4-179 | 2-Me, 4-Ph  | Me                                  | COtBu   |
| 4-180 | 2-Me, 4-Ph  | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-181 | 2-Me, 4-Ph  | Et                                  | H       |
| 4-182 | 2-Me, 4-Ph  | Et                                  | COtBu   |
| 4-183 | 2-Me, 4-Ph  | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-184 | 2-Me, 4-Ph  | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-185 | 2-Me, 4-Ph  | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-186 | 2-Me, 4-Ph  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-187 | 2-Me, 4-Ph  | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |

|       |                             |                                     |         |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-188 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-189 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-190 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-191 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-192 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-193 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | H                                   | COtBu   |
| 4-194 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | H       |
| 4-195 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | COtBu   |
| 4-196 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-197 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | H       |
| 4-198 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | COtBu   |
| 4-199 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-200 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-201 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-202 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-203 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-204 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-205 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-206 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-207 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-208 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-209 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | H                                   | COtBu   |
| 4-210 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | H       |
| 4-211 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | COtBu   |
| 4-212 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-213 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | H       |
| 4-214 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | COtBu   |
| 4-215 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-216 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |

|       |                             |                                     |         |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-217 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-218 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-219 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-220 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-221 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-222 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-223 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-224 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-225 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | H                                   | COtBu   |
| 4-226 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | H       |
| 4-227 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | COtBu   |
| 4-228 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-229 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Et                                  | H       |
| 4-230 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Et                                  | COtBu   |
| 4-231 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-232 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-233 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-234 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-235 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-236 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-237 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-238 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-239 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-240 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-241 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | H                                   | COtBu   |
| 4-242 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | Me                                  | H       |
| 4-243 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | Me                                  | COtBu   |
| 4-244 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-245 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | Et                                  | H       |

|       |                                |                                     |         |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-246 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Et                                  | COtBu   |
| 4-247 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-248 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-249 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-250 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-251 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-252 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-253 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-254 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-255 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-256 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-257 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | H                                   | COtBu   |
| 4-258 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | H       |
| 4-259 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | COtBu   |
| 4-260 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-261 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | H       |
| 4-262 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | COtBu   |
| 4-263 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-264 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-265 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-266 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-267 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-268 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-269 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-270 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-271 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-272 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-273 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | COtBu   |
| 4-274 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | H       |

|       |                      |                                     |                       |
|-------|----------------------|-------------------------------------|-----------------------|
| 4-275 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu                 |
| 4-276 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt               |
| 4-277 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H                     |
| 4-278 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu                 |
| 4-279 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 4-280 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt               |
| 4-281 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H                     |
| 4-282 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu                 |
| 4-283 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt               |
| 4-284 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H                     |
| 4-285 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu                 |
| 4-286 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt               |
| 4-287 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                     |
| 4-288 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu                 |
| 4-289 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt               |
| 4-290 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | H                                   | COtBu                 |
| 4-291 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | H                     |
| 4-292 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu                 |
| 4-293 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt               |
| 4-294 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H                     |
| 4-295 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu                 |
| 4-296 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt               |
| 4-297 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H                     |
| 4-298 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu                 |
| 4-299 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt               |
| 4-300 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H                     |
| 4-301 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu                 |
| 4-302 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt               |
| 4-303 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                     |

|       |                      |                                     |         |
|-------|----------------------|-------------------------------------|---------|
| 4-304 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-305 | 2, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-306 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | H                                   | COtBu   |
| 4-307 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | H       |
| 4-308 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 4-309 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-310 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | H       |
| 4-311 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 4-312 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-313 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-314 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-315 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-316 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-317 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-318 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-319 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-320 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-321 | 3, 5-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-322 | 2-Cl, 6-Br           | H                                   | COtBu   |
| 4-323 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | H       |
| 4-324 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | COtBu   |
| 4-325 | 2-Cl, 6-Br           | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-326 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | H       |
| 4-327 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | COtBu   |
| 4-328 | 2-Cl, 6-Br           | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-329 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-330 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-331 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-332 | 2-Cl, 6-Br           | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |

|       |            |                                     |         |
|-------|------------|-------------------------------------|---------|
| 4-333 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-334 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-335 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-336 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-337 | 2-Cl, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-338 | 2-Br       | H                                   | COtBu   |
| 4-339 | 2-Br       | Me                                  | H       |
| 4-340 | 2-Br       | Me                                  | COtBu   |
| 4-341 | 2-Br       | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-342 | 2-Br       | Et                                  | H       |
| 4-343 | 2-Br       | Et                                  | COtBu   |
| 4-344 | 2-Br       | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-345 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-346 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-347 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-348 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-349 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-350 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-351 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-352 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-353 | 2-Br       | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-354 | 2-Br, 4-Me | H                                   | COtBu   |
| 4-355 | 2-Br, 4-Me | Me                                  | H       |
| 4-356 | 2-Br, 4-Me | Me                                  | COtBu   |
| 4-357 | 2-Br, 4-Me | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-358 | 2-Br, 4-Me | Et                                  | H       |
| 4-359 | 2-Br, 4-Me | Et                                  | COtBu   |
| 4-360 | 2-Br, 4-Me | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-361 | 2-Br, 4-Me | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |

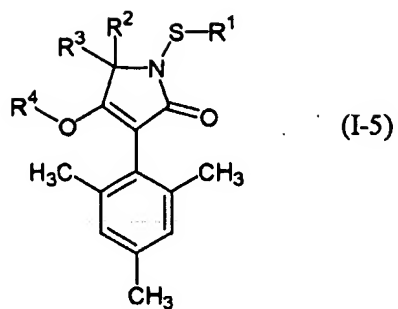
|       |  |                                     |         |
|-------|--|-------------------------------------|---------|
| 4-362 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-363 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-364 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-365 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-366 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-367 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-368 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-369 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-370 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | H                                   | COtBu   |
| 4-371 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | H       |
| 4-372 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | COtBu   |
| 4-373 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | C(S)SEt |
| 4-374 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | H       |
| 4-375 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | COtBu   |
| 4-376 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-377 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | H       |
| 4-378 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COtBu   |
| 4-379 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |
| 4-380 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | H       |
| 4-381 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COtBu   |
| 4-382 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt |
| 4-383 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H       |
| 4-384 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu   |
| 4-385 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt |
| 4-386 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                  | H                                   | COtBu   |
| 4-387 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                  | Et                                  | H       |
| 4-388 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                  | Et                                  | COtBu   |
| 4-389 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                  | Et                                  | C(S)SEt |
| 4-392 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | C(S)SEt |



|       |                         |                                     |                    |
|-------|-------------------------|-------------------------------------|--------------------|
| 4-395 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | C(S)SEt            |
| 4-396 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                  |
| 4-397 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COtBu              |
| 4-398 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | C(S)SEt            |
| 4-399 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr              |
| 4-400 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | Me                                  | COcPr              |
| 4-401 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-OMe-Ph)       |
| 4-402 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-Me-Ph)        |
| 4-403 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | Me                                  | COcPr              |
| 4-404 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | Me                                  | COcPr(1-Me)        |
| 4-405 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr              |
| 4-406 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr(1-Me)        |
| 4-407 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr              |
| 4-408 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr(1-Me)        |
| 4-409 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | H                  |
| 4-410 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COMe               |
| 4-411 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COEt               |
| 4-412 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | COiPr              |
| 4-413 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO <sub>2</sub> Et |
| 4-414 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | H                  |
| 4-415 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COMe               |
| 4-416 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COEt               |
| 4-417 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COiPr              |
| 4-418 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr              |
| 4-419 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO <sub>2</sub> Et |

表 5

138



| 化合物番号 | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>          |
|-------|----------------|----------------|----------------|-------------------------|
| 5-1   | Me             | Me             | Me             | H                       |
| 5-2   | Me             | Me             | Me             | Ac                      |
| 5-3   | Me             | Me             | Me             | COEt                    |
| 5-4   | Me             | Me             | Me             | COPr                    |
| 5-5   | Me             | Me             | Me             | COiPr                   |
| 5-6   | Me             | Me             | Me             | COBu                    |
| 5-7   | Me             | Me             | Me             | COtBu                   |
| 5-8   | Me             | Me             | Me             | COcHex                  |
| 5-9   | Me             | Me             | Me             | COPh                    |
| 5-10  | Me             | Me             | Me             | CO(2-Cl-Ph)             |
| 5-11  | Me             | Me             | Me             | COCH=CH <sub>2</sub>    |
| 5-12  | Me             | Me             | Me             | COC(Me)=CH <sub>2</sub> |
| 5-13  | Me             | Me             | Me             | COCH <sub>2</sub> OMe   |
| 5-14  | Me             | Me             | Me             | COCH <sub>2</sub> OPh   |
| 5-15  | Me             | Me             | Me             | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 5-16  | Me             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> Me      |
| 5-17  | Me             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> Et      |
| 5-18  | Me             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> Pr      |
| 5-19  | Me             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> iPr     |
| 5-20  | Me             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> Bu      |
| 5-21  | Et             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> iBu     |
| 5-22  | Me             | Me             | Me             | CO <sub>2</sub> tBu     |

|      |    |    |    |  |
|------|----|----|----|--|
| 5-23 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> cPent  |
| 5-24 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> cHex   |
| 5-25 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                     |
| 5-26 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                    |
| 5-27 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-Thf)                                |
| 5-28 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 5-29 | Me | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH (Me) iPr  |
| 5-30 | Me | Me | Me | C(O) SMe   |
| 5-31 | Me | Me | Me | C(O) SEt   |
| 5-32 | Me | Me | Me | C(O) S-tBu   |
| 5-33 | Me | Me | Me | C(O) SPh   |
| 5-34 | Me | Me | Me | C(S) OMe   |
| 5-35 | Me | Me | Me | C(S) OEt   |
| 5-36 | Me | Me | Me | C(S) OtBu  |
| 5-37 | Me | Me | Me | C(S) OPh   |
| 5-38 | Me | Me | Me | C(S) SMe   |
| 5-39 | Me | Me | Me | C(S) SEt   |
| 5-40 | Me | Me | Me | C(S) SPr   |
| 5-41 | Me | Me | Me | C(S) S-iPr   |
| 5-42 | Me | Me | Me | C(S) SBu   |
| 5-43 | Me | Me | Me | C(S) S-tBu   |
| 5-44 | Me | Me | Me | C(S) SCH <sub>2</sub> tBu  |
| 5-45 | Me | Me | Me | C(S) SPh   |
| 5-46 | Me | Me | Me | Me   |
| 5-47 | Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OMe  |
| 5-48 | Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> OPh  |
| 5-49 | Me | Me | Me | CH <sub>2</sub> Ph   |
| 5-50 | Me | Me | Me | SO <sub>2</sub> Me   |
| 5-51 | Me | Me | Me | SO <sub>2</sub> Et   |

|      |    |   |    |                              |
|------|----|---|----|------------------------------|
| 5-52 | Me | Me  | Me | SO <sub>2</sub> Ph           |
| 5-53 | Me | Me  | Me | SO <sub>2</sub> Ph (4-Me)    |
| 5-54 | Me | Me  | Me | P(S) (OMe) <sub>2</sub>      |
| 5-55 | Me | Me  | Me | P(S) (OEt) <sub>2</sub>      |
| 5-56 | Me | Me  | Me | Na                           |
| 5-57 | Me | Me  | Me | K                            |
| 5-58 | Me | Me  | Me | NH <sub>4</sub> <sup>+</sup> |
| 5-59 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | H                            |
| 5-60 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | COtBu                        |
| 5-61 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-62 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | C(S)SEt                      |
| 5-63 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | H                            |
| 5-64 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | COtBu                        |
| 5-65 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-66 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | C(S)SEt                      |
| 5-67 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | H                            |
| 5-68 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | COtBu                        |
| 5-69 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-70 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | C(S)SEt                      |
| 5-71 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | H                            |
| 5-72 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | COtBu                        |
| 5-73 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-74 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | C(S)SEt                      |
| 5-75 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | H                            |
| 5-76 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | COtBu                        |
| 5-77 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-78 | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | C(S)SEt                      |
| 5-79 | Et | Me  | Me | H                            |
| 5-80 | Et | Me  | Me | Ac                           |

|       |    |    |    |   |
|-------|----|----|----|---|
| 5-81  | Et | Me | Me | COEt  |
| 5-82  | Et | Me | Me | COPr  |
| 5-83  | Et | Me | Me | COiPr   |
| 5-84  | Et | Me | Me | COBu  |
| 5-85  | Et | Me | Me | COtBu   |
| 5-86  | Et | Me | Me | COcHex  |
| 5-87  | Et | Me | Me | COPh  |
| 5-88  | Et | Me | Me | CO(2-Cl-Ph)   |
| 5-89  | Et | Me | Me | COCH=CH <sub>2</sub>  |
| 5-90  | Et | Me | Me | COC(Me)=CH <sub>2</sub>   |
| 5-91  | Et | Me | Me | COCH <sub>2</sub> OMe   |
| 5-92  | Et | Me | Me | COCH <sub>2</sub> OPh   |
| 5-93  | Et | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 5-94  | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> Me  |
| 5-95  | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> Et  |
| 5-96  | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> Pr  |
| 5-97  | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> iPr   |
| 5-98  | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> Bu  |
| 5-99  | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> iBu   |
| 5-100 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> tBu   |
| 5-101 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> cPent   |
| 5-102 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> cHex  |
| 5-103 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                    |
| 5-104 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 5-105 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-Thf)                               |
| 5-106 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 5-107 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH(Me)iPr   |
| 5-108 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OiPr                  |
| 5-109 | Et | Me | Me | CO <sub>2</sub> CH(Me)iPr   |

|       |    |    |    |   |
|-------|----|----|----|---|
| 5-110 | Et | Me | Me | $\text{CO}_2\text{C}(\text{Me})_2\text{C}\equiv\text{CH}$ |
| 5-111 | Et | Me | Me | $\text{CO}_2\text{CH}(\text{Me})\text{tBu}$               |
| 5-112 | Et | Me | Me | $\text{CO}_2\text{CH}(\text{iPr})_2$                      |
| 5-113 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{O})\text{SMe}$                            |
| 5-114 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{O})\text{SEt}$                            |
| 5-115 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{O})\text{S-tBu}$                          |
| 5-116 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{O})\text{SPh}$                            |
| 5-117 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{OMe}$                            |
| 5-118 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{OEt}$                            |
| 5-119 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{OtBu}$                           |
| 5-120 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{OPh}$                            |
| 5-121 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{SMe}$                            |
| 5-122 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{SEt}$                            |
| 5-123 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{SPr}$                            |
| 5-124 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{S-iPr}$                          |
| 5-125 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{SBu}$                            |
| 5-126 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{S-tBu}$                          |
| 5-127 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{SCH}_2\text{tBu}$                |
| 5-128 | Et | Me | Me | $\text{C}(\text{S})\text{SPh}$                            |
| 5-129 | Et | Me | Me | Me  |
| 5-130 | Et | Me | Me | $\text{CH}_2\text{OMe}$                                   |
| 5-131 | Et | Me | Me | $\text{CH}_2\text{OPh}$                                   |
| 5-132 | Et | Me | Me | $\text{CH}_2\text{Ph}$                                    |
| 5-133 | Et | Me | Me | $\text{SO}_2\text{Me}$                                    |
| 5-134 | Et | Me | Me | $\text{SO}_2\text{Et}$                                    |
| 5-135 | Et | Me | Me | $\text{SO}_2\text{Ph}$                                    |
| 5-136 | Et | Me | Me | $\text{SO}_2(4\text{-Me-Ph})$                             |
| 5-137 | Et | Me | Me | $\text{P}(\text{S})(\text{OMe})_2$                        |
| 5-138 | Et | Me | Me | $\text{P}(\text{S})(\text{OEt})_2$                        |

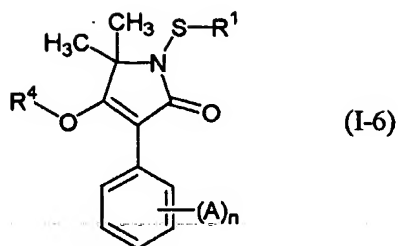
|       |     |   |    |                              |
|-------|-----|---|----|------------------------------|
| 5-139 | Et  | Me  | Me | Na                           |
| 5-140 | Et  | Me  | Me | K                            |
| 5-141 | Et  | Me  | Me | NH <sub>4</sub> <sup>+</sup> |
| 5-142 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | H                            |
| 5-143 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | CotBu                        |
| 5-144 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-145 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |    | C(S)SEt                      |
| 5-146 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | H                            |
| 5-147 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | CotBu                        |
| 5-148 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-149 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(Me)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  |    | C(S)SEt                      |
| 5-150 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | H                            |
| 5-151 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | CotBu                        |
| 5-152 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-153 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |    | C(S)SEt                      |
| 5-154 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | H                            |
| 5-155 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | CotBu                        |
| 5-156 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-157 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | C(S)SEt                      |
| 5-158 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | H                            |
| 5-159 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | CotBu                        |
| 5-160 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-161 | Et  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |    | C(S)SEt                      |
| 5-162 | Pr  | Me  | Me | H                            |
| 5-163 | Pr  | Me  | Me | CotBu                        |
| 5-164 | Pr  | Me  | Me | COCH <sub>2</sub> tBu        |
| 5-165 | Pr  | Me  | Me | CO(S)SEt                     |
| 5-166 | iPr | Me  | Me | H                            |
| 5-167 | iPr | Me  | Me | CotBu                        |

|       |                    |    |    |                       |
|-------|--------------------|----|----|-----------------------|
| 5-168 | iPr                | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 5-169 | iPr                | Me | Me | CO(S)SEt              |
| 5-170 | Bu                 | Me | Me | H                     |
| 5-171 | Bu                 | Me | Me | COtBu                 |
| 5-172 | Bu                 | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 5-173 | Bu                 | Me | Me | CO(S)SEt              |
| 5-174 | iBu                | Me | Me | H                     |
| 5-175 | iBu                | Me | Me | COtBu                 |
| 5-176 | iBu                | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 5-177 | iBu                | Me | Me | CO(S)SEt              |
| 5-178 | tBu                | Me | Me | H                     |
| 5-179 | tBu                | Me | Me | COtBu                 |
| 5-180 | tBu                | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 5-181 | tBu                | Me | Me | CO(S)SEt              |
| 5-182 | CH <sub>2</sub> Ph | Me | Me | H                     |
| 5-183 | CH <sub>2</sub> Ph | Me | Me | COtBu                 |
| 5-184 | CH <sub>2</sub> Ph | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 5-185 | CH <sub>2</sub> Ph | Me | Me | CO(S)SEt              |
| 5-186 | Ph                 | Me | Me | H                     |
| 5-187 | Ph                 | Me | Me | COtBu                 |
| 5-188 | Ph                 | Me | Me | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 5-189 | Ph                 | Me | Me | CO(S)SEt              |
| 5-190 | Me                 | Me | Me | COcPr                 |

表 6



145

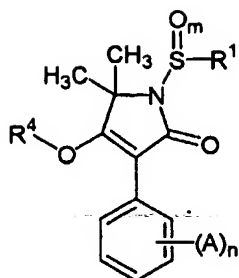


| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>  | R <sup>1</sup> | R <sup>4</sup>        |
|-------|-------------------|----------------|-----------------------|
| 6-1   | 2-Cl              | Me             | H                     |
| 6-2   | 2-Cl              | Me             | CotBu                 |
| 6-3   | 2-Cl              | Me             | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 6-4   | 2-Cl              | Me             | C(S)SEt               |
| 6-5   | 2-CF <sub>3</sub> | Me             | H                     |
| 6-6   | 2-CF <sub>3</sub> | Me             | CotBu                 |
| 6-7   | 2-CF <sub>3</sub> | Me             | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 6-8   | 2-CF <sub>3</sub> | Me             | C(S)SEt               |
| 6-9   | 2-Cl, 4-Me        | Me             | H                     |
| 6-10  | 2-Cl, 4-Me        | Me             | CotBu                 |
| 6-11  | 2-Cl, 4-Me        | Me             | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 6-12  | 2-Cl, 4-Me        | Me             | C(S)SEt               |
| 6-13  | 2-Cl, 4-Me        | Et             | H                     |
| 6-14  | 2-Cl, 4-Me        | Et             | CotBu                 |
| 6-15  | 2-Cl, 4-Me        | Et             | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 6-16  | 2-Cl, 4-Me        | Et             | C(S)SEt               |
| 6-17  | 2-Cl, 4-Me        | Pr             | H                     |
| 6-18  | 2-Cl, 4-Me        | Pr             | CotBu                 |
| 6-19  | 2-Cl, 4-Me        | Pr             | COCH <sub>2</sub> tBu |
| 6-20  | 2-Cl, 4-Me        | Pr             | C(S)SEt               |
| 6-21  | 2-Cl, 4-Me        | iPr            | H                     |
| 6-22  | 2-Cl, 4-Me        | iPr            | CotBu                 |
| 6-23  | 2-Cl, 4-Me        | iPr            | COCH <sub>2</sub> tBu |

|      |                      |     |                        |
|------|----------------------|-----|------------------------|
| 6-24 | 2-Cl, 4-Me           | iPr | C(S)SEt                |
| 6-25 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me  | H                      |
| 6-26 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me  | COtBu                  |
| 6-27 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me  | COCH <sub>2</sub> tBu  |
| 6-28 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me  | C(S)SEt                |
| 6-29 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et  | H                      |
| 6-30 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et  | COtBu                  |
| 6-31 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et  | COCH <sub>2</sub> tBu  |
| 6-32 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Et  | C(S)SEt                |
| 6-33 | 2-Br, 4-Me           | Me  | H                      |
| 6-34 | 2-Br, 4-Me           | Me  | COtBu                  |
| 6-35 | 2-Br, 4-Me           | Me  | COCH <sub>2</sub> tBu  |
| 6-36 | 2-Br, 4-Me           | Me  | C(S)SEt                |
| 6-37 | 2-Me, 4-OMe          | Me  | H                      |
| 6-38 | 2-Me, 4-OMe          | Me  | COtBu                  |
| 6-39 | 2-Me, 4-OMe          | Me  | COCH <sub>2</sub> tBu  |
| 6-40 | 2-Me, 4-OMe          | Me  | C(S)SEt                |
| 6-41 | 2-Cl                 | Et  | C(S)SEt                |
| 6-42 | 2-Cl                 | Me  | CO(2-Cl-Ph)            |
| 6-43 | 2-Cl                 | Me  | P(S)(OEt) <sub>2</sub> |
| 6-44 | 2-Cl                 | tBu | C(S)SEt                |
| 6-45 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | Me  | COcPr                  |
| 6-46 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me  | COcPr                  |

表 7

147



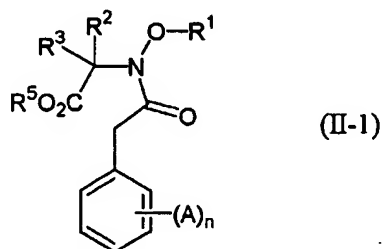
(I-7)

| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>        | R <sup>1</sup> | m | R <sup>4</sup>  |
|-------|-------------------------|----------------|---|---|
| 7-1   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | H   |
| 7-2   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | COtBu   |
| 7-3   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 7-4   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | CO <sub>2</sub> Me  |
| 7-5   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 7-6   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 7-7   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | C(S)SEt   |
| 7-8   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 1 | C(S)SPr   |
| 7-9   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | H   |
| 7-10  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | COtBu   |
| 7-11  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 7-12  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | CO <sub>2</sub> Me  |
| 7-13  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 7-14  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 7-15  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | C(S)SEt   |
| 7-16  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me             | 2 | C(S)SPr   |
| 7-17  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et             | 1 | H   |
| 7-18  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et             | 1 | COtBu   |
| 7-19  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et             | 1 | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 7-20  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et             | 1 | CO <sub>2</sub> Me  |
| 7-21  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et             | 1 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 7-22  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et             | 1 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |

148

|      |                         |    |   |   |
|------|-------------------------|----|---|---|
| 7-23 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 1 | C(S)SEt   |
| 7-24 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 1 | C(S)SPr   |
| 7-25 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | H   |
| 7-26 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | COtBu   |
| 7-27 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | COCH <sub>2</sub> tBu   |
| 7-28 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | CO <sub>2</sub> Me  |
| 7-29 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> tBu                                   |
| 7-30 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 7-31 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | C(S)SEt   |
| 7-32 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et | 2 | C(S)SPr   |

表 8



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>        | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>     | R <sup>5</sup> |
|-------|-------------------------|----------------|---|--------------------|----------------|
| 8-1   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | H   | H                  | Me             |
| 8-2   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | Me  | H                  | Me             |
| 8-3   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | Me  | Me                 | Me             |
| 8-4   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | Me  | Et                 | Me             |
| 8-5   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | Me  | iPr                | Me             |
| 8-6   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | Me             |
| 8-7   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | Me             |
| 8-8   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                    | Me             |
| 8-9   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | Me             |
| 8-10  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | Me             |

|      |                         |    |   |                    |    |
|------|-------------------------|----|---|--------------------|----|
| 8-11 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | H   | H                  | Et |
| 8-12 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | Me  | H                  | Et |
| 8-13 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | Me  | Me                 | Et |
| 8-14 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | Me  | Et                 | Et |
| 8-15 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | Me  | iPr                | Et |
| 8-16 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | Et |
| 8-17 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | Et |
| 8-18 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                    | Et |
| 8-19 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | Et |
| 8-20 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | Et |
| 8-21 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | H   | H                  | Me |
| 8-22 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | H                  | Me |
| 8-23 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | Me                 | Me |
| 8-24 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | Et                 | Me |
| 8-25 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | iPr                | Me |
| 8-26 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | Me |
| 8-27 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | Me |
| 8-28 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                    | Me |
| 8-29 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | Me |
| 8-30 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -       |                    | Me |
| 8-31 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | H   | H                  | Et |
| 8-32 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | H                  | Et |
| 8-33 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | Me                 | Et |
| 8-34 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | Et                 | Et |
| 8-35 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | iPr                | Et |
| 8-36 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me  | CH <sub>2</sub> Ph | Et |
| 8-37 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |                    | Et |
| 8-38 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                    | Et |
| 8-39 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                    | Et |

|      |                         |  |   |    |
|------|-------------------------|--|---|----|
| 8-40 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me   | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | Et |
| 8-41 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Et   | Me  | Me |
| 8-42 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Pr   | Me  | Me |
| 8-43 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | iPr  | Me  | Me |
| 8-44 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                   | Me  | Me |
| 8-45 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH                                 | Me  | Me |
| 8-46 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> Ph                                   | Me  | Me |
| 8-47 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cHex                                 | Me  | Me |
| 8-48 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Me  | Me |
| 8-49 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me  | Me |
| 8-50 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Me  | Me |
| 8-51 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe | Me  | Me |
| 8-52 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SMe                                  | Me  | Me |
| 8-53 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>                 | Me  | Me |
| 8-54 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> (2-Diox)                             | Me  | Me |
| 8-55 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> (2-Thf)                              | Me  | Me |
| 8-56 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> (2-Pyr)                              | Me  | Me |
| 8-57 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> (3-Pyr)                              | Me  | Me |
| 8-58 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph                  | Me  | Me |
| 8-59 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CHCl                              | Me  | Me |
| 8-60 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | H  | Me  | Me |
| 8-61 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | Me   | Me  | Me |
| 8-62 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Me  | Me |
| 8-63 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me  | Me |
| 8-64 | 2, 4-Cl <sub>2</sub>    | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                  | Me  | Me |
| 8-65 | 2-Cl, 4-Me              | H  | Me  | Me |
| 8-66 | 2-Cl, 4-Me              | Me   | Me  | Me |
| 8-67 | 2-Cl, 4-Me              | CH <sub>2</sub> OMe                                  | Me  | Me |
| 8-68 | 2-Cl, 4-Me              | CH <sub>2</sub> OEt                                  | Me  | Me |

|      |                             |                                     |    |    |    |
|------|-----------------------------|-------------------------------------|----|----|----|
| 8-69 | 2-Cl, 4-Me                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-70 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-71 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-72 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-73 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-74 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-75 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-76 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-77 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-78 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-79 | 2, 3-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-80 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-81 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-82 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-83 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-84 | 2, 4-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-85 | 2, 5-Me <sub>2</sub>        | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-86 | 2, 5-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-87 | 2, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-88 | 2, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-89 | 2, 5-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-90 | 2, 6-Me <sub>2</sub>        | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-91 | 2, 6-Me <sub>2</sub>        | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-92 | 2, 6-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-93 | 2, 6-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-94 | 2, 6-Me <sub>2</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-95 | 2-Me, 4-Br                  | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-96 | 2-Me, 4-Br                  | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-97 | 2-Me, 4-Br                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |

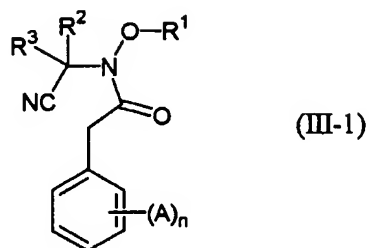
|       |                             |                                     |    |    |    |
|-------|-----------------------------|-------------------------------------|----|----|----|
| 8-98  | 2-Me, 4-Br                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-99  | 2-Me, 4-Br                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-100 | 2-Me, 4-OMe                 | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-101 | 2-Me, 4-OMe                 | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-102 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-103 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-104 | 2-Me, 4-OMe                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-105 | 2-Me, 4-Ph                  | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-106 | 2-Me, 4-Ph                  | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-107 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-108 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-109 | 2-Me, 4-Ph                  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-110 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-111 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-112 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-113 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-114 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-Ph | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-115 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-116 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-117 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-118 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-119 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-CN | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-120 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-121 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-122 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-123 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-124 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-125 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-126 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>  | Me                                  | Me | Me | Et |



|       |                                |                                     |    |    |    |
|-------|--------------------------------|-------------------------------------|----|----|----|
| 8-127 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-128 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-129 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-130 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 4-Cl | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-131 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 4-Cl | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-132 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 4-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-133 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 4-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-134 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 4-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-135 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-136 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-137 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-138 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-139 | 2, 6-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-140 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-141 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-142 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-143 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-144 | 2, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-145 | 3, 5-Cl <sub>2</sub>           | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-146 | 3, 5-Cl <sub>2</sub>           | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-147 | 3, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-148 | 3, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-149 | 3, 5-Cl <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-150 | 2-Cl, 6-Br                     | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-151 | 2-Cl, 6-Br                     | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-152 | 2-Cl, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-153 | 2-Cl, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-154 | 2-Cl, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-155 | 2-Br                           | H                                   | Me | Me | Et |

|       |  |                                     |    |    |    |
|-------|--|-------------------------------------|----|----|----|
| 8-156 | 2-Br                                     | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-157 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-158 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-159 | 2-Br                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-160 | 2-Br, 4-Me                               | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-161 | 2-Br, 4-Me                               | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-162 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-163 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-164 | 2-Br, 4-Me                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-165 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-166 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-167 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-168 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-169 | 2, 6-Cl <sub>2</sub> , 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |
| 8-170 | 2-Cl                                     | H                                   | Me | Me | Et |
| 8-171 | 2-Cl                                     | Me                                  | Me | Me | Et |
| 8-172 | 2-Cl                                     | CH <sub>2</sub> OMe                 | Me | Me | Et |
| 8-173 | 2-Cl                                     | CH <sub>2</sub> OEt                 | Me | Me | Et |
| 8-174 | 2-Cl                                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | Me | Me | Et |

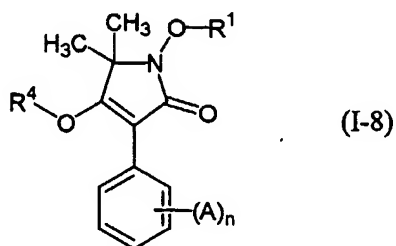
表 9



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>        | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> |
|-------|-------------------------|----------------|----------------|----------------|
| 9-1   | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H              | Me             | Me             |

|      |                         |    |   |
|------|-------------------------|----|---|
| 9-2  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |
| 9-3  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |
| 9-4  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |
| 9-5  | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | H  | Me            Me  |
| 9-6  | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |
| 9-7  | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |
| 9-8  | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | H  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |
| 9-9  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | Me            Me  |
| 9-10 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |
| 9-11 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |
| 9-12 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |
| 9-13 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | Me | Me            Me  |
| 9-14 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -  |
| 9-15 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |
| 9-16 | 2, 6-Me <sub>2</sub>    | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |

表 1 0



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>     | R <sup>1</sup>      | R <sup>4</sup>       |
|-------|----------------------|---------------------|----------------------|
| 10-1  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OMe  |
| 10-2  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OEt  |
| 10-3  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPr  |
| 10-4  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiPr |
| 10-5  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OBu  |

|       |                      |                                     |                                    |
|-------|----------------------|-------------------------------------|------------------------------------|
| 10-6  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-7  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-8  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-9  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-10 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-11 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-12 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-13 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-14 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-15 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-16 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-17 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-18 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-19 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-20 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-21 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-22 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-23 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-24 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-25 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-26 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-27 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-28 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-29 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-30 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-31 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-32 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-33 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-34 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiPr               |

|       |                      |                                     |                                    |
|-------|----------------------|-------------------------------------|------------------------------------|
| 10-35 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-36 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-37 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-38 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-39 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-40 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-41 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-42 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-43 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-44 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-45 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-46 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-47 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-48 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-49 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-50 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-51 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-52 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-53 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-54 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-55 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-56 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-57 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-58 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-59 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-60 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-61 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-62 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-63 | 2-Me, 6-Cl           | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OPr                |

|       |            |                                     |                                    |
|-------|------------|-------------------------------------|------------------------------------|
| 10-64 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-65 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-66 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-67 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-68 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-69 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-70 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-71 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-72 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-73 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-74 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-75 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-76 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-77 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-78 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-79 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-80 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-81 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-82 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-83 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-84 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-85 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-86 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-87 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-89 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-89 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-90 | 2-Me, 6-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-91 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-92 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                |

|        |            |                                     |                                    |
|--------|------------|-------------------------------------|------------------------------------|
| 10-93  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-94  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-95  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-96  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-97  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-98  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-99  | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-100 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-101 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-102 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-103 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-104 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-105 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-106 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-107 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-108 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-109 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-110 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-111 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-112 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-113 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-114 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-115 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-116 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-117 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-118 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-119 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-120 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> OEt                 | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-121 | 2-Me, 6-Br | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OMe                |

|        |                                |                                     |                                    |
|--------|--------------------------------|-------------------------------------|------------------------------------|
| 10-122 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OEt                |
| 10-123 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPr                |
| 10-124 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiPr               |
| 10-125 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OBu                |
| 10-126 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OiBu               |
| 10-127 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OsBu               |
| 10-128 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OtBu               |
| 10-129 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> OPh                |
| 10-130 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> SMe                |
| 10-131 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> CN                 |
| 10-132 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> C(O)OEt            |
| 10-133 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> |
| 10-134 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> C≡CH               |
| 10-135 | 2-Me, 6-Br                     | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CH <sub>2</sub> Ph                 |
| 10-136 | 2-Cl, 6-F                      | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-137 | 2-Br, 4, 6-Me <sub>2</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                |
| 10-138 | 2, 3, 6-Me <sub>3</sub>        | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr                              |
| 10-139 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> , 6-Me    | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                              |
| 10-140 | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub> , 3-Cl | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                              |
| 10-141 | 2, 3, 4, 6-Me <sub>4</sub>     | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                              |
| 10-142 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-tBu   | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                              |
| 10-143 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-OMe   | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO(2-OMe-Ph)                       |
| 10-144 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-OMe   | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                              |
| 10-145 | 2, 6-Me <sub>2</sub> , 4-OMe   | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-OMe-Ph)                       |
| 10-146 | 2, 6-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | Ac                                 |
| 10-147 | 2, 6-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COiPr                              |
| 10-148 | 2, 6-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                              |
| 10-149 | 2, 6-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr(1-Me)                        |
| 10-150 | 2, 6-Me <sub>2</sub>           | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr(2-Me)                        |



|        |                      |                                     |   |
|--------|----------------------|-------------------------------------|---|
| 10-151 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr (1-Me, 2, 2-Cl <sub>2</sub> )           |
| 10-152 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COC (Me) <sub>2</sub> Et                      |
| 10-153 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COC (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl      |
| 10-154 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl          |
| 10-155 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcBu   |
| 10-156 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPent                                       |
| 10-157 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcHex  |
| 10-158 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCCl=CH <sub>2</sub>                         |
| 10-159 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (2-Cl-Ph)                                  |
| 10-160 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (2-Me-Ph)                                  |
| 10-161 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO <sub>2</sub> Me                            |
| 10-162 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO <sub>2</sub> Et                            |
| 10-163 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (S) Me                                     |
| 10-164 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CONMe <sub>2</sub>                            |
| 10-165 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | C (S) NMe <sub>2</sub>                        |
| 10-166 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OEt                           |
| 10-167 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr   |
| 10-168 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr (1-Me)                                  |
| 10-169 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr (1-Ph)                                  |
| 10-170 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr (1- (4-OEt-Ph) , 2, 2-Cl <sub>2</sub> ) |
| 10-171 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcBu   |
| 10-172 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCCl=CH <sub>2</sub>                         |
| 10-173 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO (3-Q <sup>3</sup> )                        |
| 10-174 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO (2-Cl-Ph)                                  |
| 10-175 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO (2-Me-Ph)                                  |
| 10-176 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO (2-OMe-Ph)                                 |
| 10-177 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | P (S) (OEt) <sub>2</sub>                      |
| 10-178 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr   |
| 10-179 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr (1-Me)                                  |

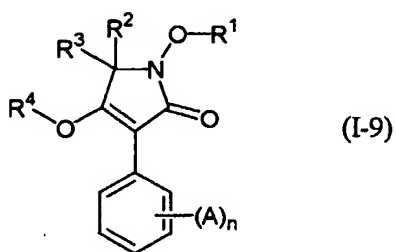
|        |                      |   |  |
|--------|----------------------|---|--|
| 10-180 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | COcBu                                    |
| 10-181 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | COC (Me) <sub>2</sub> Et                 |
| 10-182 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | COC (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl |
| 10-183 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | COC (Me) <sub>2</sub> OAc                |
| 10-184 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (2-Me-Ph)                             |
| 10-185 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (2-Cl-Ph)                             |
| 10-186 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (2-OMe-Ph)                            |
| 10-187 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CO <sub>2</sub> Me                       |
| 10-188 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> CN                       |
| 10-189 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> OMe                      |
| 10-190 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | CH <sub>2</sub> SMe                      |
| 10-191 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | H   | COcPr                                    |
| 10-192 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Pr  | COcPr                                    |
| 10-193 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | cPr   | COcPr                                    |
| 10-194 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH                                | COcPr                                    |
| 10-195 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CN                                  | COCH <sub>2</sub> tBu                    |
| 10-196 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr                                    |
| 10-197 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH (Me) CH <sub>2</sub> OMe                         | COcPr                                    |
| 10-198 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> (3-Thf)                             | CO (2-OMe-Ph)                            |
| 10-199 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> (3-Thf)                             | CO (2-Me-Ph)                             |
| 10-200 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | 3-Thf   | COcPr                                    |
| 10-201 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | 3-Thf   | CO (2-OMe-Ph)                            |
| 10-202 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | CO (3-Me-3-Q <sup>3</sup> )              |
| 10-203 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | COC (Me) <sub>2</sub> OMe                |
| 10-204 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | COC (Me) <sub>2</sub> OEt                |
| 10-205 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | COC (Me) (Et) OMe                        |
| 10-206 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | COC (Et) <sub>2</sub> OMe                |
| 10-207 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | COcPent (1-OMe)                          |
| 10-208 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                                 | COcHex (1-OMe)                           |

|        |                      |                                     |                                     |
|--------|----------------------|-------------------------------------|-------------------------------------|
| 10-209 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COC (Me) <sub>2</sub> OMe           |
| 10-210 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COC (Me) <sub>2</sub> OEt           |
| 10-211 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COC (Me) (Et) OMe                   |
| 10-212 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COC (Et) <sub>2</sub> OMe           |
| 10-213 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCpent (1-OMe)                     |
| 10-214 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COC <sub>6</sub> Hex (1-OMe)        |
| 10-215 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COC (Me) <sub>2</sub> OMe           |
| 10-216 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COC (Me) <sub>2</sub> OEt           |
| 10-217 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COC (Me) (Et) OMe                   |
| 10-218 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COC (Et) <sub>2</sub> OMe           |
| 10-219 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COCpent (1-OMe)                     |
| 10-220 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COC <sub>6</sub> Hex (1-OMe)        |
| 10-221 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCPr                               |
| 10-222 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCPr (1-Me)                        |
| 10-223 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCPr (2-Me)                        |
| 10-224 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCPr (1-CN)                        |
| 10-225 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCPr (1-Me, 2, 2-Cl <sub>2</sub> ) |
| 10-226 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCPr (2, 2, 3, 3-Me <sub>4</sub> ) |
| 10-227 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCBu                               |
| 10-228 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (3-Me-3-Q <sup>3</sup> )         |
| 10-229 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | COCClC=CH <sub>2</sub>              |
| 10-230 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO (2-Cl-Ph)                        |
| 10-231 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCPr                               |
| 10-232 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCPr (1-Me)                        |
| 10-233 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCPr (1-CN)                        |
| 10-234 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCBu                               |
| 10-235 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO (3-Me-3-Q <sup>3</sup> )         |
| 10-236 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COCClC=CH <sub>2</sub>              |
| 10-237 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | COPh                                |

|        |                      |                                     |                                 |
|--------|----------------------|-------------------------------------|---------------------------------|
| 10-238 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-Me-Ph)                     |
| 10-239 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-Cl-Ph)                     |
| 10-240 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-OMe-Ph)                    |
| 10-241 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(3-OMe-Ph)                    |
| 10-242 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(4-OMe-Ph)                    |
| 10-243 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-F-Ph)                      |
| 10-244 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2, 4-(OMe) <sub>2</sub> -Ph) |
| 10-245 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2, 6-(OMe) <sub>2</sub> -Ph) |
| 10-246 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(3, 5-(OMe) <sub>2</sub> -Ph) |
| 10-247 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2, 4-F <sub>2</sub> -Ph)     |
| 10-248 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(3-Pyr)                       |
| 10-249 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-OMe-3-Pyr)                 |
| 10-250 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr                           |
| 10-251 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcBu                           |
| 10-252 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COPh                            |
| 10-253 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO(2-Me-Ph)                     |
| 10-254 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO(2-OMe-Ph)                    |
| 10-255 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO(3-Pyr)                       |
| 10-256 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr                           |
| 10-257 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OMe                 | COcPr(1-Me)                     |
| 10-258 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OMe                 | CO(2-OMe-Ph)                    |
| 10-259 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr                           |
| 10-260 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr(1-Me)                     |
| 10-261 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPr(1-CN)                     |
| 10-262 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcBu                           |
| 10-263 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | COcPent                         |
| 10-264 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(3-Me-3-Q <sup>3</sup> )      |
| 10-265 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-Me-Ph)                     |
| 10-266 | 2-Cl                 | CH <sub>2</sub> OEt                 | CO(2-OMe-Ph)                    |

|        |      |                                     |                            |
|--------|------|-------------------------------------|----------------------------|
| 10-267 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> OEt                 | P(S)(OEt) <sub>2</sub>     |
| 10-268 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr                      |
| 10-269 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr(1-Me)                |
| 10-270 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPr(1-CN)                |
| 10-271 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcBu                      |
| 10-272 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | COcPent                    |
| 10-273 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO(3-Me-3-Q <sup>3</sup> ) |
| 10-274 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO(2-Me-Ph)                |
| 10-275 | 2-Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | CO(2-OMe-Ph)               |

表 1 1



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>     | R <sup>1</sup>      | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup>                                      | R <sup>4</sup> |
|-------|----------------------|---------------------|---|---|----------------|
| 11-1  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-Q <sup>4</sup> ) | H              |
| 11-2  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> (2-Thf)                             | H              |
| 11-3  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                  | H              |
| 11-4  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> Ph                                  | H              |
| 11-5  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> cHex                                | H              |
| 11-6  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph                  | H              |
| 11-7  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                 | H              |
| 11-8  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |   | H              |
| 11-9  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |   | CO(2-OMe-Ph)   |
| 11-10 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)                           | H              |
| 11-11 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (2-Cl-Ph)                           | H              |

|       |                      |                     |   |                            |                     |
|-------|----------------------|---------------------|---|----------------------------|---------------------|
| 11-12 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -  |                            | COcPr               |
| 11-13 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | Et                         | H                   |
| 11-14 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph) | H                   |
| 11-15 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> (3-Me-Ph)  | H                   |
| 11-16 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Me  | CH <sub>2</sub> (3-OMe-Ph) | H                   |
| 11-17 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | Et                         | H                   |
| 11-18 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | Et                         | CO (2-OMe-Ph)       |
| 11-19 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | iPr                        | H                   |
| 11-20 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -  |                            | H                   |
| 11-21 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -  |                            | CH <sub>2</sub> OEt |
| 11-22 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (2-Cl-Ph)  | H                   |
| 11-23 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (3-Cl-Ph)  | H                   |
| 11-24 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)  | H                   |
| 11-25 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)  | CO (2-OMe-Ph)       |
| 11-26 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (2-Me-Ph)  | H                   |
| 11-27 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (3-Me-Ph)  | H                   |
| 11-28 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph) | H                   |
| 11-29 | 2, 4-Cl <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | Me  | 4-OMe-Ph                   | CO <sub>2</sub> Me  |
| 11-30 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | H                   |
| 11-31 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | COcPr               |
| 11-32 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OEt) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | H                   |
| 11-33 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OEt) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | COMe                |
| 11-34 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OEt) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | COEt                |
| 11-35 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OEt) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | COiPr               |
| 11-36 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> OEt) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                            | COcPr               |
| 11-37 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                            | H                   |
| 11-38 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                            | COMe                |
| 11-39 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                            | COEt                |
| 11-40 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                |                            | COiPr               |

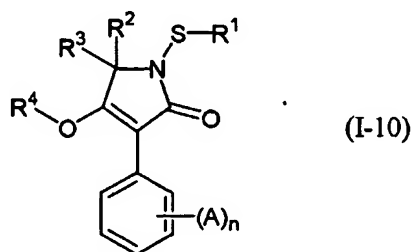
|       |                      |                     |  |                    |
|-------|----------------------|---------------------|--|--------------------|
| 11-41 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                               | COcPr              |
| 11-42 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |
| 11-43 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe               |
| 11-44 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt               |
| 11-45 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-46 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-47 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |
| 11-48 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe               |
| 11-49 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt               |
| 11-50 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-51 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-52 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | H                  |
| 11-53 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | COcPr              |
| 11-54 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | H                  |
| 11-55 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | COcPr              |
| 11-56 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |
| 11-57 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-58 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-59 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COtBu              |
| 11-60 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et |
| 11-61 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-62 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | COcPr              |
| 11-63 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | COcPr              |
| 11-64 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                               | COcPr              |
| 11-65 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |
| 11-66 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt               |
| 11-67 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-68 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-69 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COtBu              |

|       |                      |                                     |  |                    |
|-------|----------------------|-------------------------------------|--|--------------------|
| 11-70 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et |
| 11-71 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |
| 11-72 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt               |
| 11-73 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-74 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-75 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COtBu              |
| 11-76 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et |
| 11-77 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me                                  | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO (2-OMe-Ph)      |
| 11-78 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | H                  |
| 11-79 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | H                                   | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-80 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe               |
| 11-81 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe               |
| 11-82 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | H                  |
| 11-83 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COMe               |
| 11-84 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COEt               |
| 11-85 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COiPr              |
| 11-86 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COcPr              |
| 11-87 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | CO <sub>2</sub> Et |
| 11-88 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |
| 11-89 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe               |
| 11-90 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt               |
| 11-91 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-92 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-93 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et |
| 11-94 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COMe               |
| 11-95 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COEt               |
| 11-96 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | COiPr              |
| 11-97 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OCH <sub>2</sub> Et) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                  | CO <sub>2</sub> Et |
| 11-98 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt                 | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                  |



|        |                      |                      |  |                    |
|--------|----------------------|----------------------|--|--------------------|
| 11-99  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt. | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe               |
| 11-100 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt               |
| 11-101 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr              |
| 11-102 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr              |
| 11-103 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | CH <sub>2</sub> OEt  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et |

表 1 2



| 化合物番号 | (A) <sub>n</sub>     | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>                     | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>      |
|-------|----------------------|----------------|------------------------------------|----------------|---------------------|
| 12-1  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | H                   |
| 12-2  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COMe                |
| 12-3  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COEt                |
| 12-4  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COiPr               |
| 12-5  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COcPr               |
| 12-6  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-7  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-8  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-9  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | H                   |
| 12-10 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COMe                |
| 12-11 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COEt                |
| 12-12 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COiPr               |
| 12-13 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | COcPr               |
| 12-14 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-15 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et             | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - |                | CO <sub>2</sub> Et  |

|       |                      |    |   |                     |
|-------|----------------------|----|---|---------------------|
| 12-16 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -   | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-17 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | H                   |
| 12-18 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COMe                |
| 12-19 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COEt                |
| 12-20 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COiPr               |
| 12-21 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COcPr               |
| 12-22 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-23 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-24 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-25 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | H                   |
| 12-26 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COMe                |
| 12-27 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COEt                |
| 12-28 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COiPr               |
| 12-29 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COcPr               |
| 12-30 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-31 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-32 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (Me) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-33 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                   |
| 12-34 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe                |
| 12-35 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt                |
| 12-36 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr               |
| 12-37 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr               |
| 12-38 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-39 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-40 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-41 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                   |
| 12-42 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe                |
| 12-43 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt                |
| 12-44 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr               |

|       |                      |    |   |                     |
|-------|----------------------|----|---|---------------------|
| 12-45 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               | COcPr               |
| 12-46 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-47 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-48 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -               | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-49 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                   |
| 12-50 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe                |
| 12-51 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt                |
| 12-52 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr               |
| 12-53 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr               |
| 12-54 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-55 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-56 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (NMe <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-57 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | H                   |
| 12-58 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COMe                |
| 12-59 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COEt                |
| 12-60 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COiPr               |
| 12-61 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COcPr               |
| 12-62 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-63 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-64 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-65 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | H                   |
| 12-66 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COMe                |
| 12-67 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COEt                |
| 12-68 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COiPr               |
| 12-69 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | COcPr               |
| 12-70 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-71 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-72 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                       | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-73 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                     | H                   |

|        |                      |    |  |                     |
|--------|----------------------|----|--|---------------------|
| 12-74  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | COMe                |
| 12-75  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | COEt                |
| 12-76  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | COiPr               |
| 12-77  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | COcPr               |
| 12-78  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-79  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-80  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NMe-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                      | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-81  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | H                   |
| 12-82  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | COMe                |
| 12-83  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | COEt                |
| 12-84  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | COiPr               |
| 12-85  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | COcPr               |
| 12-86  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-87  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-88  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> OEt)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                 | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-89  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | H                   |
| 12-90  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COMe                |
| 12-91  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt                |
| 12-92  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr               |
| 12-93  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr               |
| 12-94  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-95  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-96  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-97  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                | H                   |
| 12-98  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                | COMe                |
| 12-99  | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                | COEt                |
| 12-100 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                | COiPr               |
| 12-101 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                | COcPr               |
| 12-102 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C(=N-OMe)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                | CO <sub>2</sub> Me  |

|        |                      |    |  |                     |
|--------|----------------------|----|--|---------------------|
| 12-103 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(=N-OMe)-(CH_2)_2-$        | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-104 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(=N-OMe)-(CH_2)_2-$        | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-105 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | H                   |
| 12-106 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | COMe                |
| 12-107 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | COEt                |
| 12-108 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | COiPr               |
| 12-109 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | COcPr               |
| 12-110 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-111 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-112 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-113 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_2O-)-(CH_2)_2-$  | H                   |
| 12-114 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | COMe                |
| 12-115 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | COEt                |
| 12-116 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | COiPr               |
| 12-117 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | COcPr               |
| 12-118 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-119 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-120 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-121 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Me | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$  | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-122 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | H                   |
| 12-123 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | COMe                |
| 12-124 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | COEt                |
| 12-125 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | COiPr               |
| 12-126 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | COcPr               |
| 12-127 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-128 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-129 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(OCH_2OEt)-(CH_2)_2-$     | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-130 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(O(CH_2)_2OMe)-(CH_2)_2-$ | H                   |
| 12-131 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-CH(O(CH_2)_2OMe)-(CH_2)_2-$ | COMe                |

|        |                      |    |   |                     |
|--------|----------------------|----|---|---------------------|
| 12-132 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COEt                |
| 12-133 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COiPr               |
| 12-134 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | COcPr               |
| 12-135 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-136 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-137 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH (O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-138 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | H                   |
| 12-139 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | COMe                |
| 12-140 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | COEt                |
| 12-141 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | COiPr               |
| 12-142 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | COcPr               |
| 12-143 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-144 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-145 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (=N-OMe) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                 | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-146 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | H                   |
| 12-147 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COMe                |
| 12-148 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COEt                |
| 12-149 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COiPr               |
| 12-150 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COcPr               |
| 12-151 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-152 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-153 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CH <sub>2</sub> OEt |
| 12-154 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | H                   |
| 12-155 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COMe                |
| 12-156 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COEt                |
| 12-157 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COiPr               |
| 12-158 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | COcPr               |
| 12-159 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Me  |
| 12-160 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C (-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -  | CO <sub>2</sub> Et  |

|        |                      |    |                                       |                     |
|--------|----------------------|----|---------------------------------------|---------------------|
| 12-161 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$ | CO <sub>2</sub> Et  |
| 12-162 | 2, 6-Me <sub>2</sub> | Et | $-(CH_2)_2-C(-O(CH_2)_3O-)-(CH_2)_2-$ | CH <sub>2</sub> OEt |

上記の例示化合物中、好適な化合物は、1-13、1-19、1-22、1-24、1-26、1-33、1-35、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-49、1-51、1-54、1-71、1-74、1-75、1-76、1-78、1-83、1-84、1-86、1-87、1-88、1-90、1-91、1-92、1-99、1-105、1-111、1-112、1-123、1-128、1-130、1-135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-143、1-144、1-146、1-147、1-148、1-151、1-152、1-154、1-155、1-156、1-158、1-159、1-160、1-166、1-167、1-168、1-169、1-171、1-192、1-299、1-321、1-390、1-391、1-392、1-393、1-394、1-395、1-396、1-397、1-398、1-399、1-400、1-410、1-411、1-412、1-414、1-415、1-416、1-417、1-418、1-419、1-420、1-421、1-425、1-426、1-427、1-429、1-430、1-431、1-432、1-433、1-435、1-440、1-441、1-442、1-443、1-444、1-445、1-447、1-448、1-449、1-450、1-451、1-456、1-457、1-458、1-459、1-460、1-462、1-463、1-466、1-467、1-473、2-3、2-5、2-6、2-8、2-9、2-11、2-12、2-14、2-19、2-20、2-22、2-23、2-24、2-25、2-34、2-66、2-105、2-107、2-112、2-137、2-142、2-178、2-194、2-371、2-393、2-426、2-507、2-509、2-510、2-513、2-556、4-104、4-107、4-399、4-400、4-401、4-402、4-403、4-404、4-405、4-406、4-407、4-408、4-410、4-411、4-414、4-415、4-416、4-418、5-67、5-70、6-4、6-41、1

0-1、10-139、10-146、10-147、10-148、10-149、10-150、10-151、10-153、10-154、10-155、10-156、10-157、10-158、10-159、10-160、10-161、10-162、10-163、10-166、10-167、10-168、10-169、10-171、10-172、10-173、10-174、10-175、10-176、10-178、10-179、10-180、10-185、10-187、10-198、10-203、10-209、10-221、10-222、10-223、10-224、10-225、10-227、10-228、10-230、10-231、10-232、10-234、10-235、10-237、10-238、10-239、10-240、10-241、10-242、10-243、10-244、10-246、10-247、10-248、10-249、10-250、10-251、10-252、10-253、10-254、10-256、10-257、10-259、10-262、11-8、11-9、11-12、11-38、11-39、11-41、11-43、11-44、11-46、11-48、11-49、11-51、11-57、11-61、11-64、11-66、11-67、11-68及び11-70番の化合物であり、

より好適には、4-104、4-107、4-399、4-400、4-401、4-402、4-403、4-404、4-405、4-406、4-407、4-408、4-410、4-411、4-414、4-415、4-416、4-418、5-67、5-70、6-4、6-41、10-146、10-147、10-148、10-149、10-155、10-156、10-159、10-160、10-167、10-168、10-171、10-176、10-178、10-179、10-180、10-238、10-240、10-256、10-259、11-38、11-39、11-43、11-44、11-48、11-49、11-66、11-67及び11-68番の化合物であり、

より更に好適には、4-403、4-407、4-410、4-411、4-415、4-416、4-418、5-67、5-70、6-4、6-41、10-148、10-149、10-168、10-179、11-43、11-44、

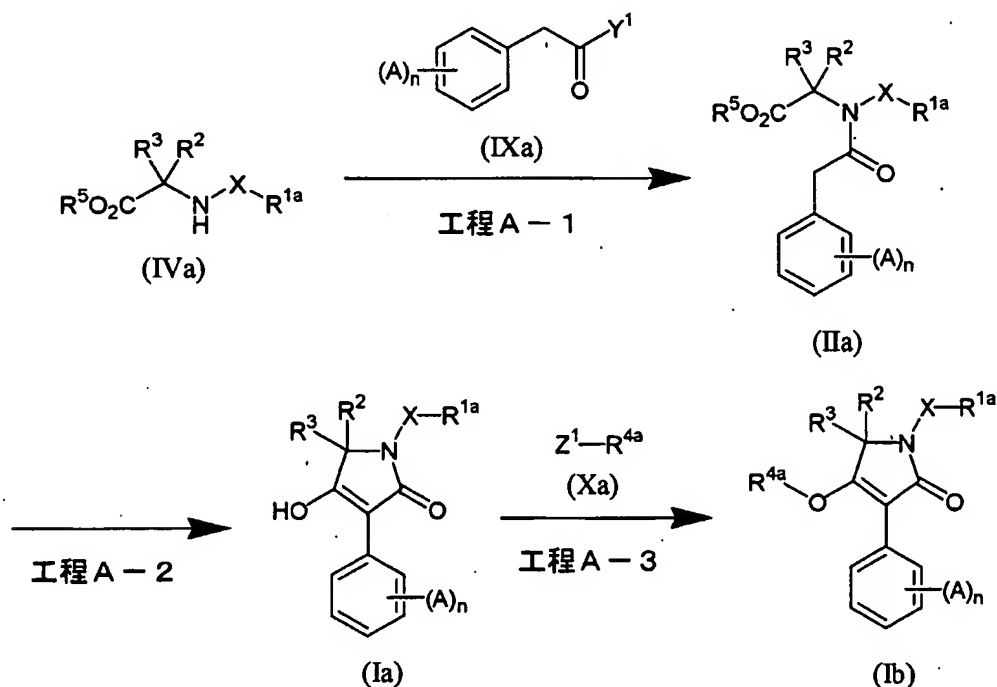


11-48及び11-49番の化合物である。

本発明のN-置換ジヒドロピロール誘導体は、以下に記載する工程A乃至工程Iの方法によって製造することができる。

工程Aは、一般式(IVa)で表されるアミノ酸誘導体をアシル化し、閉環することにより、本発明の一般式(Ia)で表されるジヒドロピロール誘導体を製造し、更に水酸基へ置換基を導入することにより、本発明の一般式(Ib)で表されるN-置換ジヒドロピロール誘導体を製造する工程である。

(工程A)



上式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $X$ 、 $A$ 及び $n$ は前記と同意義を示し、  
 $R^{1a}$ は、水素原子を除く他、 $R^1$ と同意義を示し、  
 $R^{4a}$ は、水素原子を除く他、 $R^4$ と同意義を示し、  
 $Y^1$ は、水酸基又はハロゲン原子を示し（好適には、水酸基、塩素原子又は臭素原子である。）、  
 $Z^1$ は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基(当

該フェニルスルホニル基は、同一又は異なったハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)を示す(好適には、塩素原子、メチルスルホニル基、フェニルスルホニル基又はトリルスルホニル基である。))。

(工程A-1)

工程A-1は、一般式(IVa)で表されるアミノ酸誘導体を、一般式(IXa)で表されるフェニル酢酸誘導体と反応させ、一般式(IIa)で表されるN-アシルアミノ酸誘導体を製造する工程である。

(i) 本工程において、化合物(IXa)中の $Y^1$ が水酸基である場合、相当する化合物(IXa)に不活性溶媒中、塩基及び縮合剤の存在下、化合物(IVa)を反応させ、化合物(IIa)を製造することができる。

用いられる塩基は、通常pH8以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類；水素化ナトリウム及び水素化カリウムのような金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドのようなアルコキシド類；トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン及びピリジンのような有機塩基類；又は、メチルリチウム、ブチルリチウム、メチルマグネシウムブロミド、リチウムジイソプロピルアミド等有機金属類等であり得、好適には、有機塩基類であり、より好適には、ピリジン又はトリエチルアミンである。

用いられる塩基の量は、化合物(IVa) 1molに対し、通常、1.0～10.0molであり、好適には、1.0～5.0molである。

用いられる縮合剤は、縮合能をもつ試薬であれば特に限定はなく、例えば、クロロギ酸メチル及びクロロギ酸エチルのようなクロロギ酸 $C_1 \sim C_4$ アルキル；ヨウ化2クロロ-1-メチルピリジニウムのようなピリジニウム塩類；又は、ジシクロヘキシルカルボジイミドのようなカルボジイミド類であり得、好適には、ピリジニ

ウム塩類であり、より好適には、ヨウ化2クロロ-1-メチルピリジニウムである。

用いられる縮合剤の量は、化合物(IVa) 1molに対し、通常、1.0~5.0molであり、好適には、1.0~2.0molである。

使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド及びN-メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ピリジン及びピコリンのようなピリジン類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類、エステル類、脂肪族炭化水素類又は芳香族炭化水素類であり、より好適には、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、酢酸エチル又はトルエンである。

用いられる溶媒の量は、化合物(IVa) 1molに対し、通常、1.0~20リットルであり、好適には、1.0~10リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、-40℃~150℃であり、好適には、0~100℃である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6分間~48時間であり、好適には、10分間~24時間である。

(ii) 本工程において、化合物(IXa)中のY<sup>1</sup>がハロゲン原子である場合、相当する化合物(IXa)に不活性溶媒中、塩基存在下、化合物(IVa)を反応させ、化合物(IIa)を製造することができる。

使用される塩基は、通常pH8以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類；水素化ナトリウム及び水

素化カリウムのような金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドのようなアルコキシド類；トリエチルアミン、N、N-ジメチルアニリン及びピリジンのような有機塩基類；又は、メチルリチウム、ブチルリチウム、メチルマグネシウムブロミド、リチウムジイソプロピルアミド等有機金属類等であり得、好適には、アルカリ金属の炭酸塩類、アルカリ金属の重炭酸塩類又は有機塩基類であり、より好適には、炭酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム、ピリジン又はトリエチルアミンである。

用いられる塩基の量は、化合物(I X a) 1molに対し、通常、1.0～10.0molであり、好適には、1.0～5.0molである。

使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N、N-ジメチルホルムアミド、N、N-ジメチルアセトアミド及びN-メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ピリジン及びピコリンのようなピリジン類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類、エステル類、脂肪族炭化水素類又は芳香族炭化水素類であり、より好適には、テトラヒドロフラン、酢酸エチル又はトルエンである。また、本工程は、上記非水溶性溶媒と水を用いて、2層系の反応を行なってもよい。

用いられる溶媒の量は、化合物(I X a) 1molに対し、通常、1.0～20リットルであり、好適には、1.0～10リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、-70℃～150℃であり、好適には、0～100℃である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6分間～48時間であり、好適には、10分間～24時間である。

本工程に使用される化合物(I V a)は、公知化合物であるか、又は公知の方法

(例えば、Tetrahedron, 1981, 37, 4245、Tetrahedron Letters, 1990, 31, 991、Synthesis, 1987, 12, 1115又はJ. Chem. Soc., 1965, 7179に記載された方法)に準じて製造することができる。

また、本工程に使用される化合物(I X a)は、市販品されているか、又は公知の方法(例えば、J. Am. Chem. Soc. 1950, 72, 4091又はJ. Am. Chem. Soc. 1936, 58, 1233に記載された方法)に準じて製造することができる。

#### (工程A-2)

工程A-2は、一般式(I I a)で表されるN-アシルアミノ酸誘導体を、不活性溶媒中、塩基と反応させ、閉環することにより、本発明化合物(I a)を製造する工程である。

本工程に用いられる塩基は、通常、塩基塩基性を示すものであれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類；水素化ナトリウム及び水素化カリウムのような金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドのようなアルコキシド類；又は、メチルリチウム、ブチルリチウム、メチルマグネシウムプロミド、リチウムジイソプロピルアミド等有機金属類等であり得、好適には、金属水素化物、アルコキシド類又は有機金属類であり、より好適には、ナトリウムメトキシド又はtert-ブトキシドである。

用いられる塩基の量は、化合物(I I a) 1 molに対し、通常、1.0～10.0 molであり、好適には、1.0～5.0 molである。

本工程に使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド及びN-メチ

ルー、2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ピリジン及びピコリンのようなピリジン類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、エステル類、脂肪族炭化水素類、アミド類又は芳香族炭化水素類であり、より好適には、テトラヒドロフラン又はN, N-ジメチルホルムアミドである。

用いられる溶媒の量は、化合物 (I I a) 1 mol に対し、通常、1.0～20リットルであり、好適には、1.0～10リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、-40℃～150℃であり、好適には、0～100℃である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応時間等により異なるが、通常、6分間～48時間であり、好適には、10分間～24時間である。

#### (工程A-3)

工程A-3は、一般式 (I a) で表されるヒドロキシジヒドロピロール誘導体を、不活性溶媒中、塩基存在下、一般式 (X a) で表される化合物を反応させ、本発明化合物 (I b) を製造する工程である。

本発明に用いられる塩基は、通常pH8以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類；水素化ナトリウム及び水素化カリウムのような金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドのようなアルコキシド類；又は、トリエチルアミン、N, N-ジメチルアニリン及びピリジンのような有機塩基類であり得、好適には、有機塩基類であり、より好適には、トリエチルアミン又はピリジンである。

用いられる塩基の量は、化合物 (I a) 1 mol に対し、通常、1.0～10.

0 molであり、好適には、1.0～5.0 molである。

用いられる溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド及びN-メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ピリジン及びピコリンのようなピリジン類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類、エステル類、脂肪族炭化水素類又は芳香族炭化水素類であり、より好適には、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、酢酸エチル又はトルエンである。

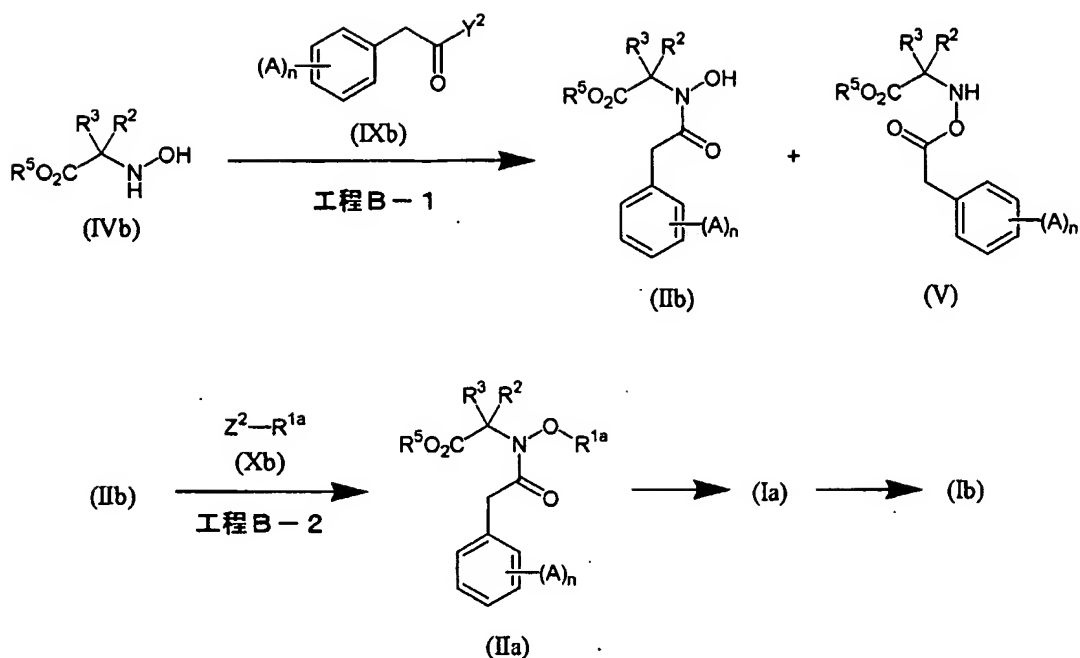
用いられる溶媒の量は、化合物(I a) 1 molに対し、通常、1.0～20リットルであり、好適には、1.0～10リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、-40℃～150℃であり、好適には、0～100℃である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6分間～48時間であり、好適には、10分間～24時間である。

工程Bは、一般式(IV b)で表されるアミノ酸誘導体をN-アシル化し、一般式(V)で表されるO-置換体が副生した場合は、一般式(II b)で表されるN-置換体に変換し、化合物(II a)の水酸基へ置換基を導入することにより、本発明の中間体である一般式(II a)で表されるN-アシルアミノ酸誘導体を製造する工程である。

(工程B)



上式中、 $R^{1a}$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $A$ 及び $n$ は前記と同意義を示し、  
 $Y^2$ は、水酸基又はハロゲン原子を示し（好適には、水酸基、塩素原子又は臭素原子である。）、  
 $Z^2$ は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、同一又は異なったハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）を示す（好適には、塩素原子、メチルスルホニル基、フェニルスルホニル基又はトリルスルホニル基である。）。

#### （工程 B-1）

工程 B-1 は、一般式 (IVb) で表されるヒドロキシルアミン誘導体を、一般式 (IXb) で表されるフェニル酢酸誘導体と反応させ、一般式 (IIb) で表される本発明中間体を製造する工程である。

本工程は、前記工程 A-1 に準じて行なうことができる。

本工程に使用される化合物 (IVb) は、公知化合物であるか、又は公知の方法（例えば、Libigs Ann. Chem., 1981, 34, 1378、Chem. Ber., 1901, 34, 1867、J. Chem. Soc., 1959, 2049又はChem. Ber., 1955, 88, 38に記載された方法）に



準じて製造することができる。

本工程において、副生物として一般式 (V) で表される  $O$ -アシル化合物が得られる場合があるが、例えば、Angew. Chem., 1988, 100, 965に記載の方法に準じて、化合物 (I I b) に変換することができる。

#### (工程 B-2)

工程 B-2 は、一般式 (I I b) で表される  $N$ -ヒドロキシ体を、不活性溶媒中、塩基存在下、一般式 (X b) で示される化合物と反応させることにより、本発明の中間体である化合物 (I I a) を製造する工程である。

本発明に用いられる塩基は、通常  $pH$  8 以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類；水素化ナトリウム及び水素化カリウムのような金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウム *tert*-ブトキシドのようなアルコキシド類；又は、トリエチルアミン、 $N,N$ -ジメチルアニリン及びピリジンのような有機塩基類であり得、好適には、金属水素化物、アルコキシド類及び有機塩基類であり、より好適には、水素化ナトリウム又はトリエチルアミンある。

用いられる塩基の量は、化合物 (I I b) 1 mol に対し、通常、1.0～5.0 mol であり、好適には、1.0～2.0 mol である。

用いられる溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類； $N,N$ -ジメチルホルムアミド、 $N,N$ -ジメチルアセトアミド及び  $N$ -メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及び

ヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ピリジン及びピコリンのようなピリジン類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類、エステル類、脂肪族炭化水素類又は芳香族炭化水素類であり、より好適には、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、酢酸エチル又はトルエンである。

用いられる溶媒の量は、化合物（I I b）1 mol に対し、通常、1.0～20リットルであり、好適には、1.0～10リットルである。

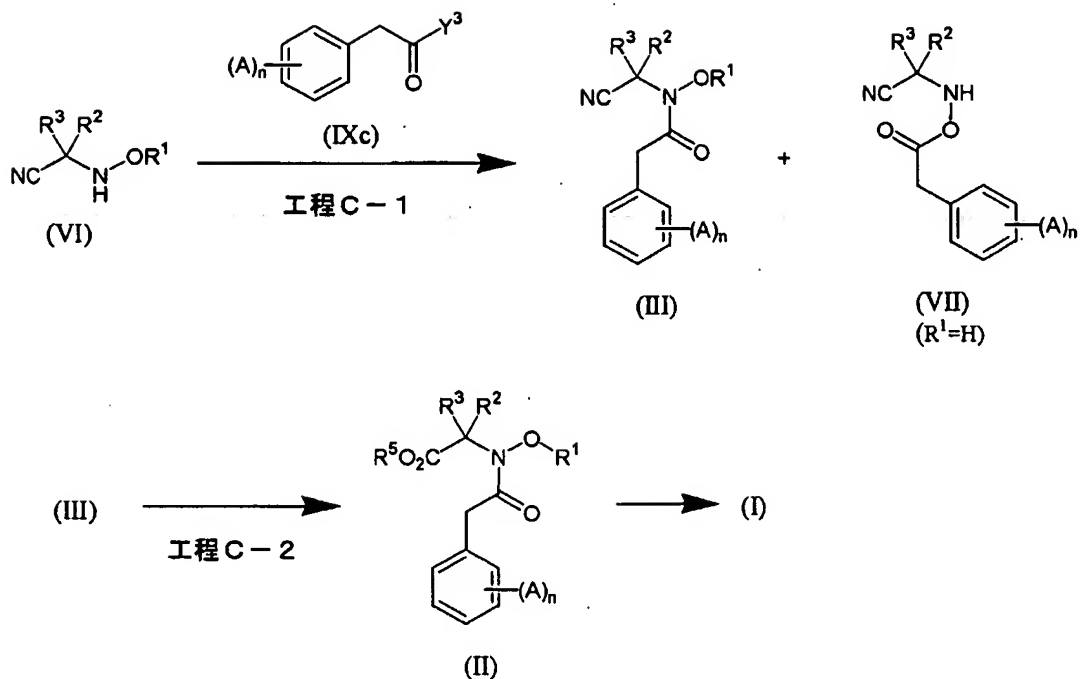
反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、 $-40^{\circ}\text{C}$ ～ $150^{\circ}\text{C}$ であり、好適には、 $0^{\circ}\text{C}$ ～ $100^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6分間～48時間であり、好適には、10分間～24時間である。

なお、化合物（I I a）を単離することなく、更に、前記工程A-2を連続して行なうことにより、本発明化合物（I a）を製造することができる。

工程Cは、一般式（V I）で表されるヒドロキシルアミン誘導体をN-アシル化し、原料化合物（V I）において $R^1$ が水素のとき、一般式（V I I）で表されるO-置換体が副生した場合は、一般式（I I I）で表される相当するN-置換体に変換し、更に所望により水酸基へ置換基を導入することにより、本発明の中間体である化合物（I I）を製造する工程である。

（工程C）



上式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、A及びnは前記と同意義を示し、Y<sup>3</sup>は、水酸基又はハロゲン原子を示す（好適には、水酸基、塩素原子又は臭素原子である。）。

#### (工程 C-1)

工程 C-1 は、一般式 (VI) で表されるヒドロキシシルアミン誘導体を、一般式 (IXc) で表されるフェニル酢酸誘導体と反応させ、一般式 (III) で表される本発明中間体を製造する工程である。

本工程は、前記工程 B-1 に準じて行なうことができる。

本工程に使用される化合物 (VI) は、公知化合物であるか、又は公知の方法（例えば、Chem. Ber., 1913, 46, 99, Chem. Ber., 1955, 88, 38又はJ. Org. Chem., 1958, 23, 964に記載された方法）に準じて製造することができる。

本工程において、R<sup>1</sup>が水素のとき、副生物として一般式 (VII) で表される O-アシル化合物が得られる場合があるが、例えば、Angew. Chem., 1988 100, 965に記載の方法に準じて、化合物 (III) に変換することができる。

## (工程C-2)

工程C-2は、化合物(III)に、酸及びアルコール類を反応させることにより、本発明化合物(II)を製造する工程である。

本工程において使用される酸は、特に限定はないが、例えば、塩酸、硫酸、過塩素酸及び硝酸のような鉱酸類；ギ酸、酢酸及びプロピオン酸のようなカルボン酸類；メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸及びp-トルエンスルホン酸一水和物のようなスルホン酸類；ピリジン塩酸塩及びトリエチルアミン塩酸塩のようなアミン類の酸付加塩；又は、塩化アルミニウム、四塩化チタン、塩化亜鉛、臭化マグネシウムのような金属ハロゲン化物及び三弗化ホウ素・エーテラートのようなルイス酸であり得、好適には、スルホン酸類である。

用いられる酸の量は、化合物(III) 1molに対し、通常、1.0～100molであり、好適には、1.0～50molである。

本工程において使用されるアルコール類は、式 $R^5OH$ （式中、 $R^5$ は前記と同意義を示す。）で表されるアルコールであり、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール又はブタノールであり得、好適には、メタノール又はエタノールである。

用いられるアルコール類の量は、化合物(III) 1molに対し、通常、1～100molであり、好適には、1～50molである。

本工程は溶媒の存在下行なうことができる。用いられる溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド及びN-メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、ハロゲン化炭化水素類、脂肪族炭化水素類又は芳香族炭化水素類であり、より好適には、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、ジクロロエタン、クロロホルム又はトルエンである。

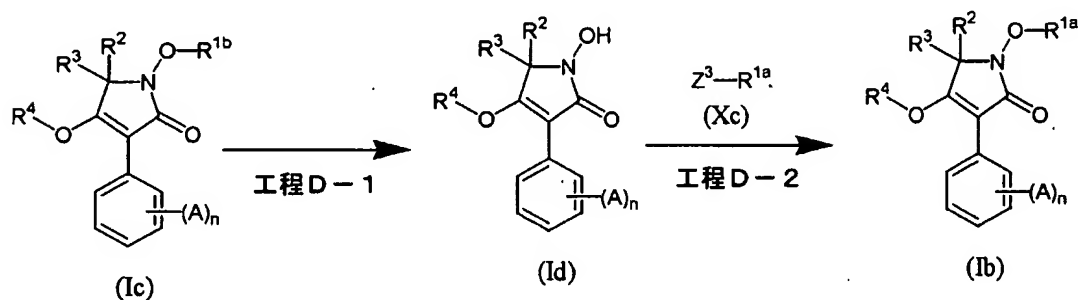
用いられる溶媒の量は、化合物 (I I I) 1mol に対し、通常、0.1～20 リットルであり、好適には、0.1～10 リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、 $-40^{\circ}\text{C}$  ～ $150^{\circ}\text{C}$  であり、好適には、 $0\sim 100^{\circ}\text{C}$  である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6 分間～48 時間であり、好適には、10 分間～24 時間である。

工程 D は、一般式 (I c) で表される本発明化合物の N-置換ジヒドロピロール誘導体の O-置換基を他の置換基に交換させることにより、本発明の化合物 (I b) を製造する工程である。

(工程 D)



上式中、 $R^{1a}$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、A 及び n は前記と同意義を示し、 $R^{1b}$  は、 $C_1\sim C_6$  アルコキシメチル基、 $(C_1\sim C_6$  アルコキシ) $C_1\sim C_6$  アルコキシメチル基又はフェノキシメチル基を示し (好適には、メトキシメチル、エトキシメチル又はフェノキシメチルである。)、 $Z^3$  は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$  アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基 (当該フェニルスルホニル基は、同一又は異なったハロゲン原子及び  $C_1\sim C_6$  アルキル基からなる群から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基により置換されてよい。) を示す (好適には、塩素原子、メチルスルホニル基、フェニルスルホニル基又はトリルスルホニル基である。))。

(工程 D-1)

工程 D-1 は、一般式 (I c) で表される化合物を、不活性溶媒中、酸又は酸素

原子に親和性のある化合物を作用せることにより、本発明化合物（I d）を製造する工程である。

使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、メタノール、エタノール、エチレングリコール及びグリセリンのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド及びN-メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；酢酸のような脂肪酸カルボン酸類；水；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、ハロゲン化炭化水素類、アルコール類又はエーテル類であり、より好適には、ジクロロメタン、メタノール又はエタノールである。

用いられる溶媒の量は、化合物（I c）1 mol に対し、通常、1.0～20.0 リットルであり、好適には、1.0～10.0 リットルである。

使用される酸は、特に限定はないが、例えば、塩酸、硫酸、過塩素酸及び硝酸のような鉱酸類；ギ酸、酢酸及びプロピオン酸のようなカルボン酸類；メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸及びp-トルエンスルホン酸一水和物のようなスルホン酸類；ピリジン塩酸塩及びトリエチルアミン塩酸塩のようなアミン類の酸付加塩；又は、塩化アルミニウム、四塩化チタン、塩化亜鉛、臭化マグネシウムのような金属ハロゲン化物及び三弗化ホウ素・エーテラートのようなルイス酸であり得、好適には、スルホン酸類である。

用いられる酸の量は、化合物（I c）1 mol に対し、通常、1.0～100 mol であり、好適には、1.0～50 mol である。

酸素原子に親和性のある化合物は、例えば、ヨウ化トリメチルシラン、臭化トリメチルシラン、塩化トリメチルシラン等のハロゲン化シラン類；トリメチルシリルトリフルオロメタンスルホナート、塩化トリメチルシリルスルホナート等のシリル

スルホナート類；又は、トリメチルシリル過塩素酸等のシリル過塩素酸類であり得、好適には臭化トリメチルシランである。

用いられる酸素原子に親和性のある化合物の量は、化合物 (I c) 1 mol に対し、通常、1.0～10.0 mol であり、好適には、1.0～5.0 mol である。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、 $-10^{\circ}\text{C}$ ～ $150^{\circ}\text{C}$ であり、好適には、室温～ $150^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6分間～48時間であり、好適には、10分間～24時間である。

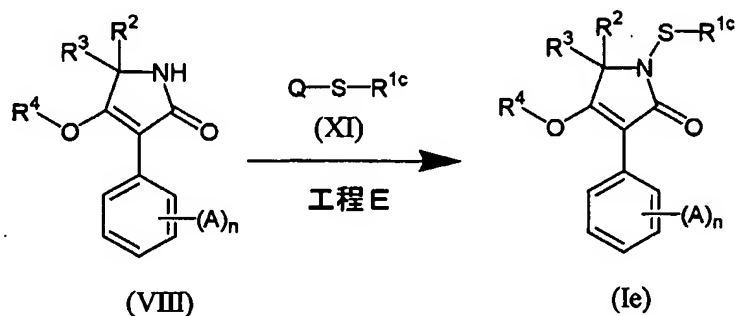
#### (工程D-2)

工程D-2は、化合物 (I d) に、不活性溶媒中、塩基存在下、一般式 (X c) で表される化合物を反応させることにより、本発明化合物 (I b) を製造する工程である。

本工程は、工程B-2に準じて行なうことができる。

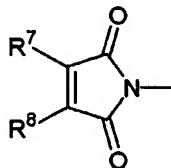
工程Eは、一般式 (V I I I) で表されるN-無置換ジヒドロピロール誘導体に、不活性溶媒中、塩基存在下、一般式 (X I) で表される化合物を反応させ、ジヒドロピロール環の窒素原子にイオウ官能基を導入することにより、本発明の化合物 (I e) を製造する工程である。

#### (工程E)



上式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、A及びnは前記と同意義を示し、 $R^{1c}$ は、水素原子を除く他、 $R^1$ と同意義を示し、

Qは、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、同一又は異なったハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又は一般式



（上式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を示し、又は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、ベンゼン環又はシクロヘキセン環を示す。）

で表される基を示す（好適には、 $R^7$ 及び $R^8$ は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、ベンゼン環である。）。

用いられる塩基は、通常pH8以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類；水素化ナトリウム及び水素化カリウムのような金属水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドのようなアルコキシド類；又は、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン及びピリジンのような有機塩基類であり得、好適には、アルカリ金属の水酸化物又はアルカリ金属の炭酸塩類であり、より好適には、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸ナトリウムである。

用いられる塩基の量は、通常、化合物(VIII) 1molに対し、1.0～10.0molであり、好適には、1.0～5.0molである。

使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、メタノール、エタノール、エチレングリコール及びグリセリンのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトンのよ



うなケトン類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；N，N－ジメチルホルムアミド、N，N－ジメチルアセトアミド及びN－メチル－2－ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；酢酸のような脂肪酸カルボン酸類；水；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、ハロゲン化炭化水素類、エーテル類、エステル類又はケトン類であり、より好適には、ジクロロメタン、酢酸エチル又はアセトンである。

用いられる溶媒の量は、化合物(VIII) 1molに対し、通常、1.0～20.0リットルであり、好適には、1.0～10リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、－40℃～150℃であり、好適には、0～100℃である。

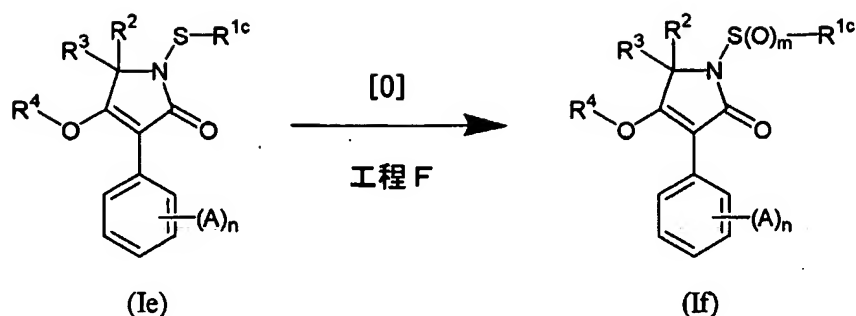
反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6分間～48時間であり、好適には、10分間～24時間である。

本工程に使用される化合物(VIII)は、例えば、特開平4－226957号公報に記載された方法に準じて製造することができる。

本工程に使用される化合物(XI)は、公知化合物であるか、又は公知の方法(例えば、J. Med. Chem., 1993, 36, 912、J. Org. Chem., 1966, 31, 2484又はJ. Org. Chem., 1969, 51, 55に記載された方法)に従い調製する事ができる。

工程Fは、一般式(Ie)で表される本発明のN－含硫黄官能基置換ジヒドロピロール誘導体を、不活性溶媒中、酸化剤を用いて硫黄原子を酸化し、一般式(I f)で表される本発明化合物を製造する工程である。

(工程F)



上式中、 $R^{1c}$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $A$ 及び $n$ は前記と同意義を示し、 $m$ は、1又は2を示す。

本工程に用いられる酸化剤は、通常の硫黄原子を酸化する酸化剤であれば特に限定はなく、例えば、過酸化水素、 $m$ -クロロ過安息香酸、過ヨウ素酸ナトリウム及びオキシソ（ペルオキシ硫酸水素カリウム含有物、イー・アイ・デュポン社登録商標）のような過酸化物； $N$ -クロロスクシンイミドのようなハロゲン化剤；次亜塩素酸ナトリウムのような次亜塩素酸塩類；又は、酸素であり得、好適には、過酸化物であり、より好適には、過酸化水素又は $m$ -クロロ過安息香酸である。

用いられる酸化剤の量は、化合物（Ie）1molに対し、通常、1.0～10.0molであり、 $n$ が1のとき、好適には、1.0～1.5molであり、 $n$ が2のとき、好適には、2.0～5.0molである。

酸化剤として過酸化水素を使用する場合、本工程は、触媒存在下酸化することができる。

用いられる触媒は、例えば、タングステン酸ナトリウムであり得る。

用いられる触媒の量は、化合物（Ie）1molに対し、通常、0.001～0.5molであり、好適には、0.001～0.2molである。

用いられる溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、メタノール、エタノール、エチレングリコール及びグリセリンのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類； $N$ 、 $N$ -ジメチルホルムアミド、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアセトアミド及び $N$ -メチル-2-ピロリドンのようなアミド類；ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類；塩化メチレン及びクロ

ロホルムのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類；ピリジン及びピコリンのようなピリジン類；アセトン、メチルエチルケトン及びシクロヘキサノンのようなケトン類；酢酸のような脂肪酸カルボン酸類；水；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、ハロゲン化炭化水素又はエステル類であり、より好適には、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、ジクロロエタン又は酢酸エチルである。

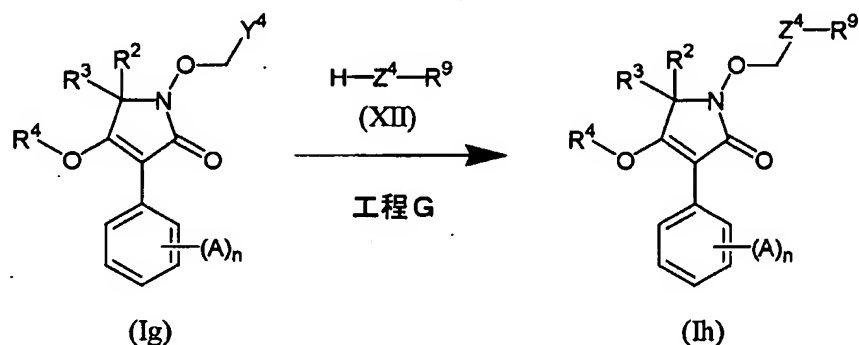
用いられる溶媒の量は、化合物 (I e) 1 mol に対し、通常、1.0～20.0 リットルであり、好適には、1.0～10.0 リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ ～ $150^{\circ}\text{C}$  であり、好適には、 $10^{\circ}\text{C}$ ～ $100^{\circ}\text{C}$  である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6 分間～48 時間であり、好適には、10 分間～24 時間である。

工程 G は、一般式 (I g) で表される本発明の O-ハロゲノメチル誘導体を、不活性溶媒中、塩基存在下、一般式 (X I I) で表されるアルコール又はチオール化合物と反応させ、一般式 (I h) で表される本発明化合物を製造する工程である。

(工程 G)



上式中、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、A 及び n は前記と同意義を示し、

$\text{Y}^4$  は、ハロゲン原子を示し（好適には、臭素原子又は塩素原子である。）、

$\text{Z}^4$  は、酸素原子又は硫黄原子を示し（好適には、酸素原子である。）、

$\text{R}^9$  は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$  アルキル基（当該アルキル基は、1 乃至 5 個のハロゲン原子により

置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルキル基又はベンジル基を示す(好適には、メチル基又はエチル基である)。

用いられる塩基は、通常pH8以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類;炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類;水素化ナトリウム及び水素化カリウムのようなアルカリ金属の水素化物;ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドのようなアルコキシド類;トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン及びピリジンのような有機塩基類;又は、メチルリチウム、ブチルリチウムのような有機金属類であり得、好適には、アルカリ金属の水素化物、アルコキシド類又は有機塩基類であり、より好適には、水素化ナトリウム、トリエチルアミン又はカリウムtert-ブトキシドである。

用いられる塩基の量は、通常、化合物(I g) 1 molに対し、1.0~10.0 molであり、好適には、1.0~5.0 molである。

使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、メタノール、エタノール、エチレングリコール及びグリセリンのようなアルコール類;ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類;ベンゼン、トルエン、キシレン及クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類;N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド及びN-メチル-2-ピロリドンのようなアミド類;ジメチルスルホキシド及びスルホランのようなスルホキシド類;酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類;ヘキサン、シクロヘキサン及びヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ピリジンのようなピリジン類;又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、エーテル類、アミド類又はスルホキシド類であり、より好適には、N,N-ジメチルホルムアミド又はテトラヒドロフランである。

用いられる溶媒の量は、化合物(I g) 1 molに対し、通常、1.0~20.0 リットルであり、好適には、1.0~10.0 リットルである。

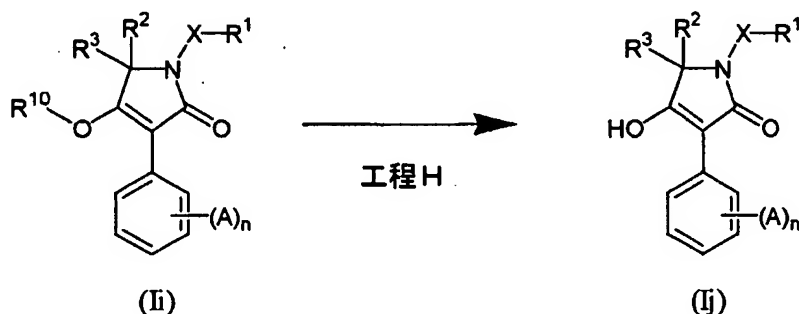
反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ ~ $150^{\circ}\text{C}$ であり、好適には、 $10^{\circ}\text{C}$ ~ $100^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、

6 分間～4 8 時間であり、好適には、1 0 分間～2 4 時間である。

工程Hは、一般式 (I i) で表される本発明のN-置換ジヒドロピロール誘導体の4位の水酸基の酸素原子に結合した置換基を、不活性溶媒中、塩基を用いて脱離させ、一般式 (I j) で表される本発明化合物を製造する工程である。

(工程H)



上式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、A、X及びnは前記と同意義を示し、 $R^{10}$ は、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、同一又は異なった1乃至5個のハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基により置換されてよい。）又は $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基（当該アルコキシカルボニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基により置換されてよい。）を示す（好適には、アセチル基、メトキシカルボニル基又はエトキシカルボニル基である。）。

用いられる塩基は、通常pH 8以上を示す塩基であれば特に限定はなく、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；水酸化カルシウム及び水酸化マグネシウムのようなアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩類；又は、炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩類であり得、好適には、アルカリ金属の水酸化物であり、より好適には、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムである。

用いられる塩基の量は、通常、化合物 (I i) 1 mol に対し、1. 0～10. 0 mol であり、好適には、1. 0～5. 0 mol である。

使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば

特に限定はなく、例えば、メタノール、エタノール、エチレングリコール及びグリセリンのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；酢酸エチル及びプロピオン酸エチルのようなエステル類；水；又は、これらの混合溶媒が挙げられ、好適には、水又はアルコール類であり、より好適には水又はメタノールである。

用いられる溶媒の量は、化合物 (I I) 1 mol に対し、通常、1.0～20.0 リットルであり、好適には、1.0～10.0 リットルである。

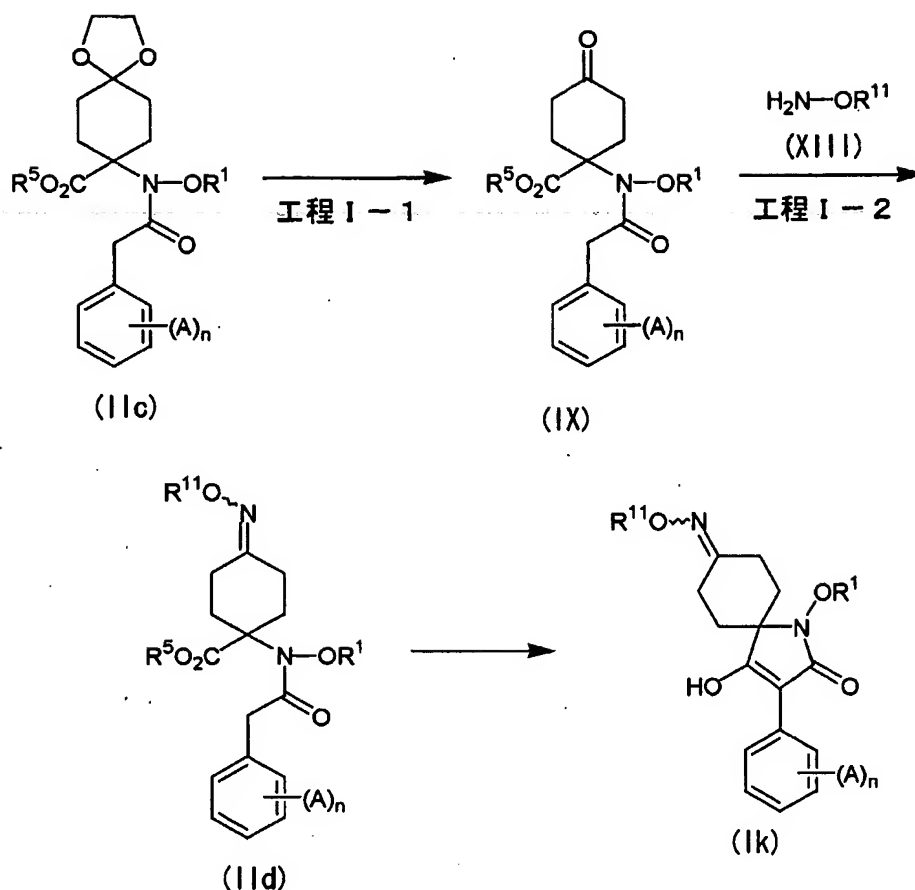
反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ ～ $150^{\circ}\text{C}$  であり、好適には、 $10^{\circ}\text{C}$ ～ $100^{\circ}\text{C}$  である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度等により異なるが、通常、6 分間～48 時間であり、好適には、10 分間～24 時間である。

上記各反応工程終了後、各工程の目的化合物は、常法に従って反応混合物から採取することができる。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、溶剤を除去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。また、各工程の目的化合物は、生成することなく、次の反応工程に用いてもよい。化合物中に水酸基が存在する場合、塩基を溶媒中、反応させることにより合成できる。

工程 I は、一般式 (I I c) で表されるアセタール誘導体のアセタール部分を、オキシムに変換することにより、本発明の中間体である化合物 (I I d) を製造する工程である。

(工程 I)



上式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^5$ 、A及びnは前記と同意義を示し、  
 $\text{R}^{11}$ は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル基（好適には、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基であり、より好適には、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基であり、更により好適には、 $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル基である。）を示す。

#### (工程 I - 1)

工程 I - 1は、一般式 (IIc) で表されるアセタール誘導体を、不活性溶媒中、酸と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるケトン誘導体を製造する工程である。

本工程に使用される酸は、特に限定はないが、例えば、塩酸、硫酸、過塩素酸及び硝酸のような鉱酸類；ギ酸、酢酸及びプロピオン酸のようなカルボン酸類；又は、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸のようなスルホン酸類であり得、好適には、

鉱酸類であり、より好適には、塩酸又は硫酸である。

用いられる酸の量は、化合物 (I I c) 1 mol に対し、通常、0.01~100 mol であり、好適には、0.1~10 mol である。

本工程に使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、水；メタノール、エタノール、プロパノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジメトキシメタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；アセトニトリルのようなニトリル類；アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、好適には水、アルコール類又はケトン類であり、より好適には、メタノール、エタノール又はアセトンである。

用いられる溶媒の量は、化合物 (I X) 1 mol に対し、通常、1.0~200 リットルであり、好適には、1.0~100 リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬及び溶媒等により異なるが、通常、-10℃~150℃であり、好適には、室温~100℃である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度により異なるが、通常1分から48時間であり、好適には、10分~24時間である。

#### (工程 I - 2)

工程 I - 2 は、化合物 (I X) に、不活性溶媒中、一般式 (X I I I) で表される O-置換ヒドロキシルアミンを反応させることにより、本発明の中間体である化合物 (I I d) を製造する工程である。

本発明に使用される化合物 (X I I I) の量は、化合物 (I X) 1 mol に対し、通常、1.0~10 mol であり、好適には、1.0~5.0 mol である。

本発明に使用される溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はなく、例えば、水；メタノール、エタノール、プロパノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジメトキシメタン、テトラヒドロフラン及びジオキサンのようなエーテル類；アセトニトリルのようなニトリル類；ギ酸、酢酸、プロピオン酸のようなカルボン酸類；又は、これらの混合溶媒であり得、好適には、水又はアルコール類であり、より好適には、水、メタノール又はエタノール



ルである。

用いられる溶媒の量は、化合物 (IX) 1 mol に対し、通常、1.0～20 リットルであり、好適には、1.0～10.0 リットルである。

反応温度は、原料化合物、反応試薬、溶媒等により異なるが、通常、 $-10^{\circ}\text{C}$ ～ $150^{\circ}\text{C}$  であり、好適には室温～ $100^{\circ}\text{C}$  である。

反応時間は、原料化合物、反応試薬、溶媒及び反応温度により異なるが、通常 1 分から 48 時間であり、好適には、10 分～24 時間である。

本発明の化合物 (I) は、水酸基を有する場合は、不活性溶媒中、塩基を用いてアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩又はアンモニウム塩にすることができる。

使用される塩基は、例えば、水酸化カリウム、水酸化ナトリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウムのようなアルカリ金属の重炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸マグネシウムのようなアルカリ土類金属の炭酸塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドのようなアルコキシド類；又は、アンモニア、メチルアミン、エチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類であり得、好適には、アルカリ金属の水酸化物又はアミン類であり、より好適には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又はアンモニアである。

使用される溶媒は、水；エチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類；メタノール、エタノールのようなアルコール類；酢酸エチルのようなエステル類；ベンゼン、トルエンのような芳香族炭化水素類；又は、ヘキサンのような脂肪族炭化水素類であり得、好適には、水又はアルコール類であり、より好適には、水、メタノール又はエタノールである。

用いられる溶媒の量は、化合物 (I) 1 モルに対し、通常 1～20 リットルであり、好適には、1～10 リットルである。

反応温度は、通常、 $-40^{\circ}\text{C}$ ～ $150^{\circ}\text{C}$  であり、好適には、 $0^{\circ}\text{C}$ ～ $100^{\circ}\text{C}$  である。

反応時間は、通常、6 分～48 時間であり、好適には、10 分～24 時間である。

本発明の化合物（I）は、上記のようなアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩又はアンモニウム塩ではなく、分子中に塩基性部分が存在する場合、溶媒存在下、酸を用いて塩にすることができる。

本発明化合物を農薬の有効成分として使用するに際しては、本発明化合物は、それ自体を用いてもよいが、農薬補助剤として製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤及びその他補助剤を配合して、例えば、乳剤、懸濁剤、粉剤、粒剤、錠剤、水和剤、水溶剤、液剤、フロアブル剤、顆粒水和剤、エアゾール剤、ペースト剤、油剤及び乳濁剤等の種々の形態に製剤することができる。これらの配合割合は、通常、有効成分0.1～9.0質量部で農薬補助剤10～99.9質量部である。

前記製剤化に際して用いられる担体は、例えば、澱粉、活性炭、大豆粉、小麦粉、木粉、魚粉、粉乳等の動植物性粉末、及び、タルク、カオリン、ベントナイト、炭酸カルシウム、ゼオライト、珪藻土、ホワイートカーボン、クレー、アルミナ等の鉱物性粉末のような固体担体；又は、水、イソプロピルアルコール、エチレングリコール等のアルコール類、シクロヘキサン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ケロシン、軽油等の脂肪族炭化水素類、キシレン、トリメチルベンゼン、テトラメチルベンゼンメチルナフタレン、ソルベントナフサ等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、脂肪酸のグリセリンエステル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類及びジメチルスルホキシド等の含硫化合物類のような液体担体であり得、好適には、固体担体又は液体担体である。

用いられる界面活性剤は、例えば、アルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル又はポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレートであり得、好適には、アルキルベンゼンスルホン酸金属塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル又はポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレートである。

その他の補助剤は、例えば、カルボキシジメチルセルロース、アラビアゴム、ア

ルギン酸ナトリウム、キサンタンガム、グアーガム、トラガントガム及びポリビニルアルコール等の固着剤又は増粘剤；金属石鹼等の消泡剤；又は、脂肪酸、アルキルリン酸塩、シリコーン及びパラフィン等の物性向上剤着色剤であり得、好適には、グアーガム又はキサンタンガムである。

これら製剤は、実際の使用に際して、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈して使用することができる。本発明化合物を含有する種々の製剤又はその希釈剤の施用は、通常一般的に行われている施用方法、即ち、散布（例えば、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粉、散粒、水面施用、箱施用等）、土壌施用（例えば、混入、灌注等）、表面施用（例えば、塗布、紛衣、被覆等）、浸漬又は毒餌等であり得る。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生、生育を防除することも可能である。又いわゆる超高濃度少量散布法により施用することもできる。この方法においては、有効成分を100%含有することが可能である。

本発明の農薬施用時の有効成分濃度は、通常、0.1～50000ppmであり、好適には、1～10000ppmである。ただし、有効成分濃度は、製剤の形態及び施用する方法、目的、時期、場所及び有害生物の発生状況によって適当に変更でき、例えば、水生有害生物の場合、上記濃度の薬液を発生場所に散布しても防除できることから、水中での有効成分濃度は上記より小さくなる。本発明の農薬の使用量は、土壌混和处理の場合、例えば、有効成分化合物として、10アール当たり、0.1～5000gであり、好適には、1～1000gである。

尚、本発明化合物は単独でも十分有効であることはいうまでもないが、必要に応じて肥料及び他の農薬、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗ウィルス剤、誘引剤、除草剤及び植物調整剤などと混用又は併用することができ、この場合に一層優れた効果を示すこともある。

本発明化合物と混用して使用できる他の農薬としては、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗ウィルス剤、誘引剤、除草剤及び植物調整剤であり得、好適には、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤又は除草剤である。

用いられる殺虫剤は、例えば、有機リン及びカーバメート系殺虫剤、ピレスロイド系殺虫剤又はその他の殺虫剤であり得る。

有機リン及びカーバメート系殺虫剤は、例えば、フェンチオン、フェントロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、オキシデブホス、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラチオン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルホス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、ジオキサベンゾホス、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、ジスルホトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルジカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロポキスル、フェノブカルブ、メトルカルブ、イソプロカルブ、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェンカルブ、ジクロフェンチオン、ピリミホスメチル、キナルホス、クロルピリホスメチル、プロチオホス、ナレド、EPN、XMC、ベンダイオカルブ、オキサミル、アラニカルブ又はクロルエトキシホスであり得る。

ピレスロイド系殺虫剤は、例えば、ペルメトリン、シペルメトリン、デルタメトリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメトリン、レスメトリン、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロックス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、ビフェントリン又はアクリナトリンであり得る。

その他の殺虫剤は、例えば、ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テフルベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、ルフエヌロン、シロマジン、メトブレン、エンドスルファン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ、テブフェノジド、クロルフェナピル、エマメクチンベンゾエート、アセタミプリド、ニテンピラム、ピメトロジン、オレイン酸ナトリウム、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、マシン油、なたね油、BT剤又は昆虫病原ウィルス等の微生物農薬であり得る。

用いられる殺ダニ剤は、例えば、クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、プロパルギット、ベンゾメート、ヘキシチアゾックス、フェンブタチンオキシド、ポリナクチン、キノメチオネート、クロルフェンソン、テトラジホン、アバメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジェノクロル、エトキサゾールでハルフェンプロックスであり得る。

用いられる殺線虫剤は、例えば、フェナミホス、ホスチアゼート、エトプロホス、メチルイソチオシアネート、1, 3-ジクロロプロペン又はDCIPであり得る。

用いられる殺菌剤は、例えば、チオフアネートメチル、ベノミル、カルベンダゾール、チアベンダゾール、フォルベット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンゼブ、ポリカーバメート、イプロベンホス、エジフェンフォス、フサライド、プロベナゾール、イソプロチオラン、クロロタロニル、キャプタン、ポリオキシシ、プラストサイジンS、カスガマイシン、ストレプトマイシン、バリダマイシン、トリシクラゾール、ピロキロン、フェナジンオキシド、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、イプロジオン、ヒメキサゾール、メタラキシル、トリフルミゾール、トリホリン、トリアジメホン、ビテルタノール、フェナリモル、プロピコナゾール、シモキサニル、ポロクロラズ、ペフラゾエート、ヘキサコナゾール、ミクロブタニル、ジクロメジン、テクロフタラム、プロピネブ、ジチアノン、ホセチル、ビンクロゾリン、プロシミドン、オキサジキシル、グアザチン、プロパモカルブ塩酸塩、フルアジナム、オキシソリニック酸、ヒドロキシイソキサゾール、イミベンコナゾール又はメパニピリムであり得る。

用いられる除草剤は、例えば、ジフルフェニカン、プロパニル、ジクロロピコリン酸、ジカンバ、ピコロラム、2, 4-D、2, 4-DB、2, 4-DP、フルロキシピル、MCPA、MCPP、トリクロピル、ジクロホップーメチル、フェノキサプロップーエチル、フルアジホップーブチル、ハロキシホップーメチル、キザロホップーエチル、ノルフルラゾン、クロルプロファム、デスメジファム、フェンメジファム、プロファム、アラクロル、アセトクロル、ブタクロル、メタザクロル、メトラクロル、プレチラクロル、プロパクロル、オリザリン、トリフルラリン、アシフルオルフェン、ピフェノックス、フルオログリゴフェン、ホメサフェン、ハロ

サフェン、ラクトフェン、オキシフルオルフェン、クロルトロン、ジウロン、フルオメツロン、イソプロツロン、リヌロン、メタベンズチアズロン、アロキシジム、クレトジム、シクロキシジム、セトキシジム、トラコキシジム、イマゼタピル、イマザメタベンズ、イマザピル、イマザキン、プロモキシニル、ジクロベニル、イオキシニル、メフェナセット、アミドスルフロン、ベンスルフロン-メチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、メトスルフロン-メチル、ニコスルフロン、ピリミスルフロン、ピラゾスルフロン-エチル、チフェンスルフロン-メチル、トリアスルフロン、トリベヌロン-メチル、ブチレート、シクロエート、ジーアレート、EPTC、エスプロカルブ、モリネート、プロスルホカルブ、ベンチオカルブ、トリアレート、アトラジン、シアナジン、シマジン、シメトリン、ターブトリン、ターブチラジン、ヘキサジノン、メタミトロン、メトリブジン、アミトリアゾール、ベンフレセート、ベントゾン、シンメチリン、クロマゾン、クロピラリド、ジフェンゾクアット、ジチオピル、エトフメセート、フルオロクロリドン、グルホシネート、グリホセート、イソキサベン、ピリデート、キンクロラック、キンメタック、スルホセート又はトリジファンであり得る。

本発明化合物は、例えば、半翅目害虫、鱗翅目害虫、鞘翅目害虫、双翅目害虫、膜翅目害虫、直翅目害虫、シロアリ目害虫、アザミウマ目害虫、ハダニ類及び植物寄生性線虫類に対して優れた防除効果を示す。また、本発明化合物は、その他有害動物、不快動物、衛生害虫及び寄生虫に対しても優れた防除効果を示す。

半翅目害虫として、例えば、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、メクラカメムシ類 (*Lygus* sp.)、アメリカコバネナガカメムシ (*Blissus leucpterus*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*) 等のカメムシ類 (異翅類; *Heteroptera*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ヒメヨコバイ (*Empoasca* sp., *Erythroneura* sp., *Circulifer* sp.) 等のヨコバイ類、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*) 等のウンカ類、*Psylla* sp.

等のキジラミ類、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、等のコナジラミ類、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、*Aphis fabae*、ニセダイコンアブラムシ (*Liphis erysimi*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*) 等のアブラムシ類、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノエカイガラムシ (*Unaspis yanoensis*) 等のカイガラムシ及びサシガメ (*Rhodnius* sp.) が挙げられる。

鱗翅目害虫として、例えば、チャハマキ (*Homona magnanima*)、コカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*)、テングハマキ (*Sparganothis pilleriana*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholitha molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、コドリंगा (*Laspeyresia pomonella*)、*Eucosma* sp.、*Lobesia botrana* 等のハマキガ類、ブドウホソハマキ (*Eupoecillia ambiguella*)、等のホソハマキガ類、*Bambalina* sp. 等のミノガ類、コクガ (*Nemapogon granelius*)、イガ (*Tinea pellionella*) 等のヒロズコガ類、ギンモンハモグリガ (*Lyonetiaprunifoliella*) 等のハモグリガ類、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*) 等のホソガ類、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*) 等のコハモグリガ類、コナガ (*Plutella xylostella*)、*Prays citri* 等のスガ類、ブドウスカシバ (*Nokona vegale*)、*Synanthedon* sp. 等のスカシバ類、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ジャガ

イモガ (*Phthorimaea operculella*)、*Stomopteryx* sp. 等のキバガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*) 等のシンクイガ類、イラガ (*Monema flavescens*) 等のイラガ類、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、*Ostrinia nubilalis*、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*) ハチミツガ (*Galleria mellonella*)、*Elasmopalpus lignosellus*、*Loxostege sticticalis* 等のメイガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、ヨモギエダシャク (*Ascotis selenaria*) 等のシャクガ類、オビカレハ (*Malacosoma neustria*) 等のカレハガ類、*Manduca sexta* 等のスズメガ類、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*)、マイマイガ (*Lymantria dispar*) 等のドクガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類、タバコバッドワーム (*Heliothis virescens*)、ボールワーム (*Helicoverpa zea*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*) 及びイラクサキンウワバ (*Trichoplusia ni*) 等のヤガ類が挙げられる。

鞘翅目害虫として、例えば、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、*Eutheolarugiceps* 等のコガネムシ類、ワイヤーワーム (*Agricotes* sp.)、*Conodeus* sp. 等のコメツキムシ類、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、インゲンテントウムシ (*Epilachna varivestis*) 等のテントウムシ類、コクヌストモドキ (*Tribolium*



m castaneum) 等のゴミムシダマシ類、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*) 等のカミキリムシ類、インゲンマメゾウムシ (*Acanthoscelides obtectus*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*) 等のマメゾウムシ類、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、コーンルートワーム (*Diabrotica* sp.)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、テンサイトビハムシ (*Chaetocnema concinna*)、*Phaedon cochlearias*、*Oulema melanopus*、*Dicladispa armigera* 等のハムシ類、*Apion godmani* 等のホソクチゾウムシ類、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*) 等のゾウムシ類、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*) 等のオサゾウムシ類、キクイムシ類、カツオブシムシ類及びシバンムシ類が挙げられる。

双翅目害虫として、例えば、キリウジガガンボ (*Tipula aino*)、イネユスリカ (*Chironomus oryzae*)、イネシントメタマバエ (*Orseolia oryzae*)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*)、イネミギワバエ (*Hydrellia griseola*)、オウトウショウジョウバエ (*Drosophila suzukii*)、フリッツフライ (*Oscinella frit*)、イネカラバエ (*Chlorops oryzae*)、インゲンモグリバエ (*Ophiomyia phaseoli*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomya hyoscyami*)、タネバエ (*Delia platura*)、ソルガムフライ (*Atherigona soccata*)、イエバエ (*Musca domestica*)、ウマバエ (*Gastrophilus* sp.)、サシバエ (*Stomoxys* sp.)、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、アカイエカ (*Culex pipiens*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*) 及びコガタアカイエカ (*Culex tr*

*itaeniorhynchus*) が挙げられる。

膜翅目害虫として、例えば、クキバチ類 (*Cephus* sp.)、カタビロコバチ (*Harmolita* sp.)、カブラハバチ (*Athalia rosea*)、スズメバチ (*Vespa mandarina*) 及びファイアーアント類が挙げられる。

直翅目害虫として、例えば、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、ケラ (*Gryllotalpa africana*)、バッタ (*Locusta migratoria migratoriodes*) 及び *Melanoplus sanguinipes* が挙げられる。

アザミウマ目害虫として、例えば、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、クロトンアザミウマ (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) 及びイネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*) が挙げられる。

ハダニ類として、例えば、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、イエローマイト (*Eotetranychus carpini*)、テキサスシトラスマイト (*Eotetranychus banksi*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、チャノホコリダニ (*polyphagotarsonemus latus*)、ヒメハダニ (*Brevipalpus* sp.)、ロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*) 及びケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*) が挙げられる。

植物寄生性線虫類として、例えば、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus* sp.)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycine*

s)、イネジンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*) 及びマツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus lignicolus*) が挙げられる。

その他有害動物、不快動物、衛生害虫及び寄生虫として、例えば、スクリミングガイ (*Pomacea canaliculata*)、ナメクジ (*Incilaria* sp.)、アフリカマイマイ (*Achatina fulica*) 等の腹足綱類 (*Gastropoda*)、ダンゴムシ (*Armadillidium* sp.)、ワラジムシ、ムカデ等の等脚目類 (*Isopoda*)、*Liposcelis* sp. 等のチャタテムシ類、*Ctenolepisma* sp. 等のシミ類、*Pulex* sp.、*Ctenocephalides* sp. 等のノミ類、*Trichodectes* sp. 等のハジラミ類、*Cimex* sp. 等のトコジラミ類、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) 等の動物寄生性ダニ類及びヒョウヒダニ類等が挙げられる。

更に、本発明化合物は、有機リン系化合物、カーバメート系化合物、合成ピレスロイド系化合物、アシルウレア系化合物又は既存の殺虫剤に抵抗性を示す害虫に対しても有効である。

本発明化合物は、落葉剤、植物生長調節剤又は除草剤として使用することができる。本発明化合物は、本質的に使用量に依存して作物に対し非選択的除草剤又は選択的除草剤として作用する。

本発明化合物は、例えば、以下の栽培植物場面における以下の雑草に対して使用することができるが、本発明は、これらに限定されるものではない。

双子葉栽培植物として、例えば、ワタ属 (*Gossypium*)、ダイズ属 (*Glycine*)、フダンソウ属 (*Beta*)、ニンジン属 (*Daucus*)、インゲンマメ属 (*Phaseolus*)、エンドウ属 (*Pisum*)、ナス属 (*Solanum*)、アマ属 (*Linum*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、ソラマメ属 (*Vicia*)、タバコ属 (*Nicotiana*)、トマト属 (*Lycopersicon*)、ラッカセイ属 (*Arachis*)、アブラナ属 (*Brassica*)、アキノノゲシ属 (*Lactuca*)、キュウリ属 (*Cucumis*) 及びウリ属 (*C*

ucurbita) が挙げられる。

双子葉雑草として、例えば、カラシ属 (Sinapis)、マメグンバイナズナ属 (Leipidium)、ヤエムグラ属 (Glium)、ハコベ属 (Stelaria)、シカギク属 (Mairicaria)、カミツレモドキ属 (Anthemis)、ガリンソガ属 (Galinsoga)、アカザ属 (Chenopodium)、イラクサ属 (Urtica)、キオン属 (Snecio)、ヒユ属 (Amaranthus)、スベリヒユ属 (Portulaca)、オナモミ属 (Xanthium)、ヒルガオ属 (Convolvulus)、サツマイモ属 (Ipomoea)、タデ属 (Polygonum)、セスバニア属 (Sesbania)、ブタクサ属 (Ambrosia)、アザミ属 (Cirsium)、ヒレアザミ属 (Carduus)、ノゲシ属 (Sonchus)、ナス属 (Solanum)、イヌガラシ属 (Rorippa)、キカシグサ属 (Rotala)、アゼナ属 (Lindernia)、ラミウム属 (Lamium)、クワガタソウ属 (Veronica)、イチビ属 (Abutilon)、エメクス属 (Emex)、チョウセンアサガオ属 (Datura)、スミレ属 (Viora)、チシマオドリコ属 (Galeopsis)、ケシ属 (Papaver)、センタウレア属 (Centaurea)、ツメクサ属 (Trifolium)、キツネノボタン属 (Ranunculus) 及びタンポポ属 (Taraxacum) が挙げられる。

単子葉栽培植物として、例えば、イネ属 (Oryza)、トウモロコシ属 (Zea)、コムギ属 (Triticum)、オオムギ属 (Hordeum)、カラスムギ属 (Avena)、ライムギ属 (Secale)、モロコシ属 (Sorghum)、キビ属 (Panicum)、サトウキビ属 (Saccharum)、アナナス属 (Ananas)、クサスギカズラ属 (Asparagus) 及びネギ属 (Allium) が挙げられる。

単子葉雑草として、例えば、ヒエ属 (Echinochloa)、エノコログサ (Setaria)、キビ属 (Panicum)、メヒシバ属 (Digitalis)、アワガリエ属 (Phleum)、スズメノカタビラ属 (Poa)、ウシノケグサ属 (Festuca)、オヒシバ属 (Eleusine)、ブラキアリア属 (Brachiaria)、ドクムギ属 (Lolium)、スズメノチャヒキ属 (Br

omus)、カラスムギ属(Avena)、カヤツリグサ属(Cyperus)、モロコシ属(Sorghum)、カモジグサ属(Agrocyron)、シノドン属(Cynodon)、ミズアオイ属(Monochoria)、テンツキ属(Fimbristylis)、オモダカ属(Sagittaria)、ハリイ属(Eleocharis)、ホタルイ属(Scirpus)、パスパルム属(Paspalum)、カモノハシ属(Ischaemum)、スフェノクレア属(Dactyloctenium)、ヌカボ属(Agrosia)、スズメノテッポウ属(Alopecurus)及びアベラ属(Apera)が挙げられる。

本発明化合物は、濃度により、例えば、樹木の存在する及び樹木の存在しない工業用地、鉄道敷地、道路及び広場の雑草の防除に適する。同様に、本発明化合物は、多年生栽培植物、例えば、造林、装飾樹木、果樹園、ぶどう園、かんきつ類の木立、くるみの果樹園、茶園、カカオの植林、小果樹の植付け及びホップ等の栽培植物中の雑草防除に用いることができ、また、一年生栽培植物中の雑草の選択的防除にも使用することができる。本発明化合物は双子葉栽培植物中、単子葉雑草の発芽前及び発芽後の選択的防除に極めて優れている。

#### [発明を実施するための最良の形態]

以下に、実施例、製剤例及び試験例を挙げて本発明化合物を具体的に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

#### (実施例1)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-13)

(1) 2-[N-メトキシ-N-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオン酸]エチルエステル (化合物番号8-33、工程A-1)

塩化(2, 4, 6-トリメチルフェニル)酢酸(101.2mg)、トリエチルアミン(0.15ml)及びジメチルアミノピリジン(5mg)をジクロロメタン

(5 ml) に溶解し、2-メトキシアミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (0.25 g) を 0℃ で加え、同温度で 1 時間攪拌した。反応終了後、ジクロロメタンを加え、ジクロロメタン層を分離し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/10) にて精製し、標記化合物 (131.1 mg、収率 41.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 4.19 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.93 (3H, s), 3.54 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.22 (6H, s), 1.54 (6H, m), 1.19 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(2) 5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-13、工程 A-2)

(1) で得られた 2-[N-メトキシ-N-[(2,4,6-トリメチルフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (131.1 mg) のジメチルホルムアミド溶液 (3 ml) に、カリウム *t*-ブトキシド (65.0 mg) を加え、室温で 30 分間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水に注ぎ、水層を分離し、ジエチルエーテルで洗浄した。水層を 1 規定塩酸にて中和し、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣を薄層クロマトグラフィー (展開溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/1) にて精製し、標記化合物 (35.4 mg、収率 31.7%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.92 (2H, s), 5.86 (1H, brd. s), 3.96 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.52 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 204-207℃)。

### (実施例 2)

2-[N-ヒドロキシ-N-[(2-クロロフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (化合物番号 8-171、工程 A-1)]

(2-クロロフェニル) 酢酸 (0.34 g)、2-メトキシアミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=メチルエステル (0.36 g) 及び、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム (0.76 g) のジクロロメタン溶液 (8 ml) にトリエチルアミン (0.42 ml) を0℃で加え、室温で2時間攪拌し、さらに3時間、還流した。反応終了後、ジクロロメタンを加え、ジクロロメタン層を水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/10) にて精製し、標記化合物 (477.0 mg、収率76.0%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.39-7.18 (4H, m), 4.15 (2H, q, J=7.0), 4.00-3.85 (2H, m), 3.91 (3H, s), 1.66-1.46 (6H, m), 1.23 (3H, t, J=7.0)。

物性: 油状物。

### (実施例3)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-99)

(1) 2-[N-ヒドロキシ-N-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセチル] アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (化合物番号8-13、工程B-1)

(2, 4, 6-トリメチルフェニル) 酢酸 (7.84 g) 及び塩化チオニル (3.37 ml) のトルエン溶液 (80 ml) に、触媒量のジメチルホルムアミド (2滴) を加え、1時間加熱還流した。溶媒を濃縮後、得られた混合物を酢酸エチル (40 ml) に溶かし、その溶液を、2-メトキシアミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (5.90 g) 及び重炭酸ナトリウム (3.70 g) を加えた酢酸エチル (60 ml) - 水 (40 ml) の混合溶媒に20℃で滴下した。滴下終了後、0℃で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を分配し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/4) にて精製し、標記化合物 (5.46、収率44.3%) と2-[(2, 4, 6

ートリメチルフェニル) アセトキシ] アミノー2-メチルプロピオニックアシッド  
=エチルエステル (2.09 g、収率17.0%) を得た。

2- [N-ヒドロキシ-N- [(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセチル]  
アミノー2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル:

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.68 (1H, s), 6.84 (2H, s), 4.01 (2H, q,  $J=7.1$ ),  
3.64 (2H, s), 2.28 (6H, s), 2.25 (3H, s), 1.32 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.1$ ).

物性: 油状物。

2- [(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセトキシ] アミノー2-メチルプロ  
ピオニックアシッド=エチルエステル:

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.68 (1H, s), 6.84 (2H, s), 4.01 (2H, q,  $J=7.1$ ), 3.64  
(2H, s), 2.28 (6H, s), 2.25 (3H, s), 1.32 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.1$ ).

物性: 油状物。

(2) 2- [N-メトキシメトキシ-N- [(2, 4, 6-トリメチルフェニル)  
アセチル] アミノー2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (化合物  
番号8-48、工程B-2)

(1) により得られた2- [N-ヒドロキシ-N- [(2, 4, 6-トリメチル  
フェニル) アセチル] アミノー2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステ  
ル (化合物番号8-13) (1.01 g) のジメチルホルムアミド溶液 (10 m  
l) に、水素化ナトリウム (60% 鉱油中、0.15 g) を0℃にて加え、同温  
度で10分間攪拌した。反応溶液に、クロロジメチルエーテル (0.30 ml) を  
0℃で加えた。同温度で1時間、室温にて2時間攪拌した後、さらにクロロジメ  
チルエーテル (0.1 ml) と水素化ナトリウム (60% 鉱油中、0.05 g) を  
0℃で加えた。同温度で1時間、室温で2時間、さらに40℃で2時間攪拌した。  
反応終了後、反応溶液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水にて洗浄し、  
硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラム  
クロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/20) にて精製し、  
標記化合物 (1.12 g、収率97.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.94 (2H, s), 4.09 (2H, q,  $J=7.3$ ), 3.90  
(2H, s), 3.63 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.52 (6H, brd. s), 1.18 (3H,



t, J=7.3)。

物性：油状物。

(3) 5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-99、工程A-2)

(2) により得られた2-[N-メトキシメトキシ-N-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (化合物番号8-48) (351.2mg) のジメチルホルムアミド溶液 (7ml) に、カリウム t-ブトキシド (123.8mg) を加え、室温にて3時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、水層を分離し、ジエチルエーテルで洗浄した。水層を1規定塩酸にて中和し、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒：酢酸エチル/ヘキサン=1/3) にて精製し、標記化合物 (227.1mg、収率73.4%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDC1<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.91 (2H, s), 6.48 (1H, brd. s), 5.01 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：151-153℃)。

#### (実施例4)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-19、工程A-3)

実施例1により得られた5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-13) (412.1mg) とトリエチルアミン (0.25ml) のジクロロメタン溶液 (5ml) に、塩化ピバロイル (0.22ml) を0℃で加えた。同温度で1時間、引き続いて室温で2時間攪拌した。反応終了後、ジクロロメタンを加え、ジクロロメタン層を分離し、水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラ

フィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝1／10）にて精製し、標記化合物（468.2mg、収率86.8%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 4.00 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：結晶（融点：101-103°C）。

#### （実施例5）

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[5,5－ジメチル－1－メトキシ－2－オキソ－3－(2,4,6－トリメチルフェニル)－2,5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル] エステル（化合物番号1－51、工程A－3）

テトラヒドロフラン（5.0ml）に、0°Cでチオホスゲン（1.4ml）、エチルメルカプタン（1.3ml）及びピリジン（1.5ml）を加え、室温で50分攪拌した。反応液を0°Cに冷却し、トリエチルアミン（2.5ml）と実施例1により得られた5,5－ジメチル－4－ヒドロキシ－1－メトキシ－2－オキソ－3－(2,4,6－トリメチルフェニル)－2,5－ジヒドロ－1H－ピロール（化合物番号1－13）（1.64g）のテトラヒドロフラン溶液（9.0ml）を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝1／7）にて精製し、標記化合物（1.60g、収率70.5%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.00 (3H, s), 2.98 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.17 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：油状物。

#### （実施例6）

炭酸＝2,2－ジメチルプロピル＝エステル＝5,5－ジメチル－1－メトキシ－2－オキソ－3－(2,4,6－トリメチルフェニル)－2,5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル＝エステル（化合物番号1－38、工程A－3）

2,2－ジメチルプロピルアルコール（156.6mg）のジクロロメタン溶液

(1 ml) に、トリホスゲン (129.3 mg) とピリジン (0.12 ml) を 0℃ で加え、同温度で 60 分間攪拌した。反応溶液を、実施例 1 により得られた 5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-13) (200 mg) とトリエチルアミン (0.20 ml) のジクロロメタン溶液 (2 ml) に 0℃ で加え、同温度で 1 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 1/10) にて精製し、標記化合物 (173.5 mg、収率 63.3%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.84 (2H, s), 4.01 (3H, s), 3.67 (2H, s), 2.21 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.54 (6H, s), 0.78 (9H, s)。

物性: 油状物。

#### (実施例 7)

5, 5-ジメチル-1-メトキシ-4-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-59、工程 A-3)

水素化ナトリウム (60% 鉱油中、12.9 mg) 及びジメチルホルムアミド (0.5 ml) の混合物に、0℃ で製造例 1 により得られた 5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-13) (27.9 mg) のジメチルホルムアミド溶液 (1.0 ml) 及びクロロジメチルエーテル (20 μl) を加え、室温で 30 分攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査を薄層クロマトグラフィー (展開溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 1/3) にて精製し、標記化合物 (25.4 mg、収率 79.5%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.85 (2H, s), 4.69 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.37 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 8)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-99、工程 B-2 及び A-2)

実施例 3 (1) により得られた 2-[N-ヒドロキシ-N-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセチル] アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチルエステル (化合物番号 8-13) (8.10 g) とクロロジメチルエーテル (1.72 ml) のジメチルホルムアミド溶液 (80 ml) に、水素化ナトリウム (60% 鉱油中、1.11 g) を 0℃ で加えた。同温度で 2 時間攪拌した後、更に水素化ナトリウム (60% 鉱油中、0.40 g) を加え、0℃ で 1 時間、室温で 2 時間攪拌した。その反応溶液に、ジメチルホルムアミド (80 ml) を加え、カリウム *t*-ブトキシド (3.60 g) を加え、同温度で 1 時間、室温で 1 時間、さらに 40℃ で 2 時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、水層を分離し、ジエチルエーテルで洗浄した。水層を 1 規定塩酸にて中和し、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒：酢酸エチル/ヘキサン=1/1) にて精製し、標記化合物 (6.44 g、収率 88.8%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.91 (2H, s), 6.48 (1H, brd. s), 5.01 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：151-153℃)。

(実施例 9)

2-[N-ヒドロキシ-N-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセチル] アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=メチルエステル (化合物番号 8-3)]

(1) N-(α-シアノ-α, α-ジメチルメチル)-N-ヒドロキシ-2-(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセタミド (化合物番号 9-1、工程 C-1)

(2, 4, 6-トリメチルフェニル) 酢酸 (5.36 g) 及び塩化チオニル (1.75 ml) のトルエン溶液 (36 ml) に、触媒量のジメチルホルムアミド (1 滴) を加え、1 時間加熱還流した。溶媒を溜去後、酢酸エチル (25 ml) に溶かし、その溶液を 2-ヒドロキシアミノ-2-メチルプロピオニトリル (2.20 g) 及び重炭酸ナトリウム (2.52 g) を溶かした酢酸エチル (40 ml) - 水 (20 ml) の混合溶媒に、0℃にて滴下した。滴下終了後、同温度にて 2 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を分配し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 1/4) にて精製し、標記化合物 (4.09 g、収率 78.5%) と 2-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセトキシ] アミノ-2-メチルプロピオニトリル (1.10 g、収率 21.1%) を得た。

N-( $\alpha$ -シアノ- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメチルメチル)-N-ヒドロキシ-2-(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセタミド:

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm): 10.36 (1H, s), 6.82 (2H, s), 3.74 (2H, s), 2.20 (3H, s), 2.13 (6H, s), 1.63 (6H, s)。

物性: アモルファス。

2-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセトキシ] アミノ-2-メチルプロピオニトリル:

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.61 (1H, s), 6.88 (2H, s), 3.79 (2H, s), 3.32 (6H, s), 2.26 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性: 油状物。

(2) 2-[N-ヒドロキシ-N-[(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセチル] アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=メチルエステル (化合物番号 8-3、工程 C-2)]

濃硫酸 (0.7 ml) に、(1) により得られた N-( $\alpha$ -シアノ- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメチルメチル)-N-ヒドロキシ-2-(2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセタミド (化合物番号 9-1, 0.30 g) のクロロホルム溶液 (5 ml) を 0℃で加え、0℃で 30 分、40℃で 1.5 時間攪拌した。反応溶液を再び 0℃に冷却し、メタノール (0.5 ml) を加え、0℃で 1 時間、40℃で 1.5 時間攪拌した。

反応終了後、反応溶液を氷に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝１／４）にて精製し、標記化合物（５６．６ｍｇ、収率１６．８％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 10.03 (1H, s), 6.78 (2H, s), 3.67 (2H, s), 3.51 (3H, s), 2.19 (3H, s), 2.10 (6H, s), 1.36 (6H, s)。

物性：油状物。

#### (実施例 10)

２，２－ジメチルプロピオニックアシッド＝５，５－ジメチル－１－クロロメトキシ－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１－１７６）

(1) ２，２－ジメチルプロピオニックアシッド＝５，５－ジメチル－１－ヒドロキシ－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１－６、Ｄ－１）

実施例４に準じて製造した２，２－ジメチルプロピオニックアシッド＝５，５－ジメチル－１－メトキシメトキシ－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１－１０５）（０．７８ｇ）のジクロロメタン溶液（１０ｍｌ）に、臭化トリメチルシラン（２．６ｍｌ）とモレキュラー・シーブ３Ａを０℃で加え、室温で３．５時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を重曹水にあげ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝１／３）にて精製し、標記化合物（０．５５ｇ、収率７９．６％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.13 (6H, s), 1.45 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：結晶（融点：１９８－１９９℃）。

(2) ２，２－ジメチルプロピオニックアシッド＝５，５－ジメチル－１－クロロメトキシ－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジ

ヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-176、工程D-2)

(1) により得られた 2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-6) (200.0 mg) のジメチルホルムアミド溶液 (2 ml) に、水素化ナトリウム (60% 鉱油中、27.8 mg) とクロロヨードメタン (50  $\mu$ l) を 0℃ にて加えた。同温度で 30 分、さらに室温で 2 時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/3) にて精製し、標記化合物 (137.4 g、収率 60.1%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.86 (2H, s), 2.26 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.08 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 124-126℃)。

#### (実施例 11)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシメトキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-180、工程G)

2, 2, 2-トリフルオロエタノール (16.6  $\mu$ l) のジメチルホルムアミド溶液 (1 ml) に、水素化ナトリウム (60% 鉱油中、11.0 mg) と、実施例 10 により得られた 2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-クロロメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-176) (90.0 mg) を 0℃ で加えた。同温度で 30 分、さらに室温で 2 時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査を薄層クロマトグラフィー (溶

出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝１／４）にて精製し、標記化合物（５７．０ｇ、収率６７．０％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 5.07 (2H, s), 4.19 (2H, q,  $J=8.8$ ), 2.26 (3H, s), 2.09 (6H, s), 1.46 (6H, s)。

物性：結晶（融点：140-141℃）。

### （実施例 12）

3, 3-ジメチルブチリックアシッド＝5, 5-ジメチル-1-シアノメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1-H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号 1-169）

（１） 3, 3-ジメチルブチリックアシッド＝5, 5-ジメチル-1-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1-H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号 1-5、工程 D-1）

実施例 4 に準じて製造した 3, 3-ジメチルブチリックアシッド＝5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1-H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号 1-111）（3.47 g）のジクロロメタン溶液（20 ml）に、臭化トリメチルシラン（11.4 ml）とモレキュラー・シーブ 3A を 0℃ で加え、室温で 3.5 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を重曹水にあげ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝１／３）にて精製し、標記化合物（2.12 g、収率 68.6％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 2.23 (3H, s), 2.17 (2H, s), 2.13 (6H, s), 1.44 (6H, s), 0.82 (9H, s)。

物性：結晶（融点：185-190℃）。

（２） 3, 3-ジメチルブチリックアシッド＝5, 5-ジメチル-1-シアノメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1-H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号 1-169、工程 D-2）

水素化ナトリウム（60％ 鉱油中、34.0 mg）のジメチルホルムアミド溶



液 (2 ml) に、(1) により得られた 3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-111) (201.7 mg) とプロモアセトニトリル (0.11 g) を 0℃ で加え、室温で 1 時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査を薄層クロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/3) にて精製し、標記化合物 (155.8 mg、収率 69.8%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 4.90 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.19 (2H, s), 2.15 (6H, s), 1.54 (6H, s), 0.83 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 81-82℃)。

### (実施例 13)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシカルボニルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-224、工程 D-2)

実施例 12 (1) により得られた 3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-5) (161.0 mg) のジクロロメタン溶液 (1.5 ml) に、クロロ炭酸メチル (0.05 ml) とトリエチルアミン (0.10 ml) を 0℃ で加え、室温で 1.5 時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査を薄層クロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/3) にて精製し、標記化合物 (171.0 mg、収率 91.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 3.95 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.19 (2H, s), 2.17 (6H, s), 1.10 (6H, s), 0.83 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 138-141℃)。

## (実施例 14)

炭酸=メチル=エステル=1-エチルチオ-5,5-ジメチル-4-メトキシカルボニル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-94)

(1) 炭酸=メチル=エステル=5,5-ジメチル-4-メトキシカルボニル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル

5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (0.70 g) とトリエチルアミン (0.60 ml) のジクロロメタン溶液 (14 ml) に、クロロ炭酸メチル (0.25 ml) を 0℃ で加えた。同温度で 1 時間、引き続いて室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、ジクロロメタンを加え、ジクロロメタン層を分離し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/10) にて精製し、標記化合物 (0.66 g、収率 76.3%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.87 (2H, s), 6.45 (1H, brd), 3.61 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.50 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 135-137℃)。

(2) 炭酸=メチル=エステル=1-エチルチオ-5,5-ジメチル-4-メトキシカルボニル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-94、工程 E)

(1) により得られた炭酸=メチル=エステル=5,5-ジメチル-4-メトキシカルボニル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロールピロール-4-イル=エステル (0.66 g)、N-エチルチオイソインドール-1,3-ジオン (0.45 g) 及び炭酸カリウム (0.3 g) のアセトン溶液 (7 ml) に超音波を 1.5 時間処理した。反応終了後、反応溶液を水にあげ、酢酸エチルにて抽出した。飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフ

イー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝１／１０）にて精製し、標記化合物（０．６６ｇ、収率８０．５％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 3.60 (3H, s), 2.89 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.26 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性：アモルファス。

#### (実施例 15)

炭酸＝３－クロロ－２，２－ジメチルプロピル＝エステル＝５，５－ジメチル－１－エチルスルフィニル－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号 7-22）  
及び炭酸＝３－クロロ－２，２－ジメチルプロピル＝エステル＝５，５－ジメチル－１－エチルスルホニル－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号 7-30）

(1) １－エチルチオ－５，５－ジメチル－４－ヒドロキシ－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール（化合物番号 5-79、工程 H）

実施例 14 により製造した炭酸＝メチル＝エステル＝１－エチルチオ－５，５－ジメチル－２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号 5-94）（０．５９ｇ）のエタノール溶液（４ｍｌ）に１規定の水酸化ナトリウム水溶液（１．６５ｍｌ）を加え、０℃で１０分、室温で３０分間攪拌した。反応溶液に１規定塩酸水溶液を加え中和し、酢酸エチルにて抽出した。飽和食塩水にて洗浄後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝１／４）にて精製し、標記化合物（４１２．１ｍｇ、収率８３．８％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.90 (2H, s), 6.80 (1H, brd. s), 2.82 (2H, q,  $J=7.4$ ), 2.27 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.47 (6H, s), 1.25 (3H, t,  $J=7.4$ ).

物性：結晶（融点：１４２－１４５℃）。

(2) 炭酸＝３－クロロ－２，２－ジメチルプロピル＝エステル＝５，５－ジメ

チルー 1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-106、工程 A-3)

3-クロロ-2, 2-ジメチルプロパノール (164.9 mg) のジクロロメタン溶液 (1 ml) に、トリホスゲン (130.0 mg) とピリジン (0.12 ml) を 0℃ で加え、同温度で 45 分間攪拌した。反応溶液を、(1) により得られた 1-エチルチオ-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 5-79) (197.8 mg) とトリエチルアミン (0.185 ml) のジクロロメタン溶液 (2 ml) に 0℃ で加え、同温度で 1 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査を薄層クロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 1/4) にて精製し、標記化合物 (249.4 mg、収率 84.5%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.84 (2H, s), 3.85 (2H, s), 3.21 (2H, s), 2.89 (5H, q, J=7.3), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.28 (6H, t, J=7.3), 0.84 (9H, s)。

物性: 油状物。

(3) 炭酸=3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル=エステル=5, 5-ジメチルー 1-エチルスルフィニル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 7-22) 及び炭酸=3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル=エステル=5, 5-ジメチルー 1-エチルスルホニル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 7-30) (工程 F)

(2) により得られた炭酸=3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル=エステル=5, 5-ジメチルー 1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-106) (110.0 mg) の 1, 2-ジクロロエタン溶液 (5 ml) に

3-クロロ過安息香酸を加え、室温で4時間攪拌した。反応溶液を重曹水にあげ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査を薄層クロマトグラフィー（溶出溶媒：酢酸エチル／ヘキサン＝1／3）にて精製し、標記化合物である炭酸＝3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル＝エステル＝5, 5-ジメチル-1-エチルスルフィニル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号7-22、90.0mg、収率77.2%）及び炭酸＝3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル＝エステル＝5, 5-ジメチル-1-エチルスルホニル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号7-30、18.2mg、収率16.1%）を得た。

炭酸＝3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル＝エステル＝5, 5-ジメチル-1-エチルスルフィニル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル＝エステル：

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.18-4.00 (1H, m), 3.84 (2H, s), 3.60-3.42 (1H, m), 3.21 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.18 3(3H, s), 2.15 (3H, s), 1.80 (3H, s), 1.53 (3H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.7$ ), 0.84 (9H, s)。

物性：油状物。

炭酸＝3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピル＝エステル＝5, 5-ジメチル-1-エチルスルホニル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル＝エステル：

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 3.84 (2H, s), 3.61 (2H, q,  $J=7.3$ ), 3.21 (2H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.80 (6H, s), 1.40 (3H, t,  $J=7.3$ ), 0.84 (6H, s)。

物性：油状物。

#### (実施例16)

3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2, 8-ジオン（化合物番号11-37）

(1) 4, 4-エチレンジオキシー-1-ヒドロキシアミノシクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル

ジイソプロピルアミン (1.55 ml) をテトラヒドロフラン (10 ml) に溶解させた。この溶液を  $-78^{\circ}\text{C}$  に冷却し、同温度で *n*-ブチルリチウムのヘキサン溶液 (1.54 mol/L, 7 ml) 及び 1, 3-ジメチル-3, 4, 5, 6-テトラヒドロ-2 (1H)-ピリミジノン (1.36 ml) を順に加え、 $-78^{\circ}\text{C}$  で 0.5 時間攪拌した。次いで、反応液に、4, 4-エチレンジオキシーシクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (1.78 g) のテトラヒドロフラン溶液 (3 ml) を加え、 $-78^{\circ}\text{C}$  で 1 時間攪拌した。更に、反応溶液に、1-クロロ-1-ニトロソシクロヘキサン (1.63 g) を加え、 $-78^{\circ}\text{C}$  で 1 時間攪拌した。更に、反応溶液に、塩酸 (1 mol/L, 16 ml) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液に炭酸水素ナトリウムを加え、pH を 9 にした後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/4) にて精製し、標記化合物 (1.47 g、収率 72.3%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 4.22 (2H, q,  $J=7.1$ ), 3.95 (4H, s), 2.20-2.00 (2H, m), 1.95-1.78 (4H, m), 1.70-1.59 (2H, m), 1.29 (3H, t,  $J=7.1$ ).

(2) 4, 4-エチレンジオキシー-1-{N-(2, 6-ジメチルフェニルアセチル)-N-ヒドロキシアミノ}シクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (工程 A-2)

(1) により得られた 4, 4-エチレンジオキシー-1-ヒドロキシアミノシクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (1.47 g) 及び炭酸水素ナトリウム (0.75 g) を酢酸エチル (8 ml) - 水 (10 ml) の混合溶媒に加えた。反応液に、2, 6-ジメチルフェニルアセティックアシッド=クロライド (1.21 g) の酢酸エチル溶液 (8 ml) を  $0^{\circ}\text{C}$  にて滴下し、 $0^{\circ}\text{C}$  で 1 時間及び室温で 3 時間攪拌した。有機層を分離し、飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/4) にて精製し、標記化合物 (0.

7.7 g、収率 32.8%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 10.06 (1H, s), 6.98 (3H, s), 4.01 (2H, q,  $J=7.1$ ), 3.87 (4H, s), 3.77 (2H, s), 2.50-1.65 (8H, s), 2.15 (6H, s), 1.11 (3H, t,  $J=7.1$ ).

(3) 4-オキソ-1-{N-(2,6-ジメチルフェニルアセチル)-N-ヒドロキシアミノ}シクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (工程 I-1)

(2) により得られた 4,4-エチレンジオキシ-1-{N-(2,6-ジメチルフェニルアセチル)-N-ヒドロキシアミノ}シクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (6.00 g) をテトラヒドロフラン (80 ml) に溶解させた。反応溶液に、塩酸 (1 mol/L, 60 ml) を加え、60℃にて 1.5 時間攪拌した。反応溶液に飽和食塩水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、得られた固体残査をジエチルエーテル-ヘキサン混合溶媒 (1:1) で洗浄し、標記化合物 (4.40 g、収率 82.8%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.09-7.00 (3H, m), 6.53 (1H, brd. s), 4.24 (2H, q,  $J=7.1$ ), 3.98 (2H, s), 2.90-2.20 (8H, m), 2.29 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.1$ ).

(4) 4-(N-メトキシイミノ)-1-{N-(2,6-ジメチルフェニルアセチル)-N-ヒドロキシアミノ}シクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (工程 I-2)

(3) により得られた 4-オキソ-1-{N-(2,6-ジメチルフェニルアセチル)-N-ヒドロキシアミノ}シクロヘキサンカルボキシリックアシッド=エチル=エステル (0.34 g) をエタノール (5 ml) に溶解させた。この溶液に、O-メチルヒドロキシルアミン・塩酸塩 (0.16 g) 及びテトラヒドロフラン (2 ml) を順に加え、室温にて 1 時間攪拌した。反応溶液に飽和食塩水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を留去後、残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/4) にて精製し、標記化合物 (0.30 g、収率 80.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.05-7.04 (3H, m), 6.36 (1H, brd. s), 4.21 (2H, q,  $J=7.0$ ),

3.95 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.10-1.80 (8H, m), 2.27 (6H, s), 1.26 (3H, t, J=7.0)。

(5) 3-(2,6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-8-(N-メトキシイミノ)-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号11-37、A-2)

水素化ナトリウム(60% 鉱油中、22.9 mg)をジメチルホルムアミド(10 ml)に溶解させ、0℃に冷却した。この溶液に、同温度にて、(4)により得られた4-(N-メトキシイミノ)-1-{N-(2,6-ジメチルフェニルアセチル)-N-ヒドロシアミノ}シクロヘキサノカルボキシリックアシッド=エチル=エステル(179.5 mg、0.447 mmol)及びヨウ化メチル(0.036 ml)を加え、室温にて2時間攪拌した。0℃にてカリウム tert-ブトキシド(80.3 mg)を加え、室温にて6時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで洗浄した後、水層を濃塩酸にて酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を除去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=3/1)にて精製し、標記化合物(128.3 mg、収率78.1%)を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.06-6.89 (3H, m), 3.81 (3H, s), 3.78 (3H, s), 2.85-2.43 (4H, m), 2.13-1.83 (4H, m), 2.00 (6H, s)。

物性: ガム状。

更に、上記実施例1～16に準じて、以下の化合物を製造した。

#### (実施例17)

2-メチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-17)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 4.00 (2H, s), 2.55 (1H, septet, J=7.0), 2.24 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.01 (6H, d, J=7.0)。

物性: 結晶 (融点: 94-95℃)。



(実施例 18)

2-クロロベンゾイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-22)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.60-7.56 (1H, m), 7.46-7.43 (2H, m), 7.33-7.24 (1H, m), 6.83 (2H, s), 4.04 (3H, s), 2.22 (9H, s), 1.58 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 143-145°C)。

(実施例 19)

2-メチルアクリル酸=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-24)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 6.14 (1H, t,  $J=1.0$ ), 5.66 (1H, t,  $J=1.5$ ), 4.01 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.84 (3H, t,  $J=1.1$ ), 1.51 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 92-95°C)。

(実施例 20)

2-フェノキシ酢酸=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-26)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.21-7.13 (2H, m), 7.01-6.93 (1H, m), 6.86 (2H, s), 6.57-6.51 (2H, m), 4.60 (2H, s), 3.99 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.13 (6H, s), 1.47 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 124-127°C)。

(実施例 21)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピ

ロールー 4-イル=エステル (化合物番号 1-27)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 4.00 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.17 (2H, s), 2.15 (6H, s), 1.48 (6H, s), 0.83 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 22)

炭酸=メチル=エステル=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロルー 4-イル=エステル (化合物番号 1-28)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 4.00 (3H, s), 3.61 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 23)

炭酸=イソブチル=エステル=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロルー 4-イル=エステル (化合物番号 1-33)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 4.00 (3H, s), 3.74 (2H, d,  $J=6.6$ ), 2.25 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.63-1.80 (1H, m), 1.53 (6H, s), 0.77 (6H, d,  $J=7.0$ )。

物性: 油状物。

(実施例 24)

炭酸=シクロペンチル=エステル=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロルー 4-イル=エステル (化合物番号 1-35)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.83-4.81 (1H, m), 4.00 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.62-1.36 (8H, m), 1.52 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 2 5)

炭酸=テトラヒドロフラン-2-イルメチル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-39)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.14 (2H, s), 4.00 (3H, s), 3.95-3.70 (3H, m), 2.25 (3H, s), 2.17 (6H, s), 2.40-1.80 (4H, m), 1.53 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 2 6)

炭酸=3-クロロ-2,2-ジメチルプロピル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-40)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.01 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.22 (2H, s), 2.25 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.54 (6H, s), 0.85 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 84-85°C)。

(実施例 2 7)

炭酸=1,2-ジメチルプロピル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-41)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 4.33 (1H, m), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.70-1.53 (1H, m), 1.58 (6H, s), 0.97 (3H, d,  $J=5.9$ ), 0.74 (6H, dd,  $J=6.6, 1.5$ )。

物性: 油状物。

(実施例 2 8)

炭酸=S-メチル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-42)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 3.99 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.20 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 29)

チオ炭酸=O-フェニル=エステル=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-49)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.36-7.20 (3H, m), 6.89 (2H, s), 6.59-6.64 (2H, m), 4.02 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.63 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 30)

ジチオ炭酸=S-プロピル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-52)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.00 (3H, s), 2.95 (2H, t,  $J=7.1$ ), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.42-1.60 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J=7.5$ )。

物性: 油状物。

(実施例 31)

ジチオ炭酸=S-イソプロピル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-53)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 3.53 (3H, s), 3.46 (1H, septet,  $J=6.7$ ), 2.22 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.55 (6H, s), 1.22 (3H, d,  $J=6.7$ )。

物性: 油状物。

(実施例 32)

ジチオ炭酸=S-ブチル=エステル=O-[5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-54)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.08 (2H, s), 4.00 (3H, s), 2.97 (2H, t,  $J=7.0$ ), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.56-1.23 (4H, m), 0.86 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

### (実施例33)

ジチオ炭酸=S-フェニル=エステル=O-[5,5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-57)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.26-7.44 (5H, m), 6.83 (2H, s), 3.98 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.09 (6H, s), 1.49 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 160-164°C)。

### (実施例34)

5,5-ジメチル-1-エトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-71)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.07 (2H, q,  $J=7.2$ ), 2.23 (3H, s), 2.06 (6H, s), 1.41 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.2$ ).

物性: 結晶 (融点: 169-171°C)。

### (実施例35)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-エトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-72)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 4.21 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.47 (6H, s), 1.36 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.07 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 3 6)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-エトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-74)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.22 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.98 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.55 (6H, s), 1.36 (3H, t,  $J=7.3$ ), 1.17 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：油状物。

(実施例 3 7)

5, 5-ジメチル-1-プロピルオキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-75)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 6.70 (1H, brd. s), 4.08-4.01 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.80-1.69 (2H, m), 1.49 (6H, s), 1.01 (3H, t,  $J=7.2$ )。

物性：結晶 (融点: 133-134°C)。

(実施例 3 8)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-プロピルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-76)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 4.12 (2H, t,  $J=6.6$ ), 2.24 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.87-1.69 (1H, m), 1.47 (6H, s), 1.07 (9H, s), 1.03 (3H, t,  $J=7.33$ )。

物性：油状物。

(実施例 3 9)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-プロピルオ

キシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-78)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.12 (2H, t,  $J=6.6$ ), 2.97 (2H, q,  $J=7.7$ ), 2.22 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.87-1.69 (2H, m), 1.55 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.7$ ), 1.03 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例 40)

5, 5-ジメチル-1-イソプロピルオキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 1-79)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, m), 6.55 (1H, brd. s), 4.23-4.24 (1H, m), 2.27 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.47 (6H, s), 1.31 (6H, d,  $J=6.2$ ).

物性: 結晶 (融点: 156-158°C)。

(実施例 41)

5, 5-ジメチル-1-アリルオキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 1-83)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.89 (2H, s), 6.69 (1H, brd. s), 6.30-6.00 (1H, m), 5.39-5.25 (2H, m), 5.30 (1H, d,  $J=1.8$ ), 4.58 (2H, d,  $J=5.9$ ), 2.27 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.48 (6H, s).

物性: 結晶 (融点: 130-133°C)。

(実施例 42)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-アリルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-84)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 6.19-5.97 (1H, m), 5.42-5.27 (2H, m),

4.66-4.62 (2H, m), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.46 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 3)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-アリルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-86)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 6.19-5.97 (1H, m), 5.42-5.27 (2H, m), 4.66-4.62 (2H, m), 2.97 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.23 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：油状物。

(実施例 4 4)

5, 5-ジメチル-1-プロパルギルオキシ-4-ヒドロキシ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-オン (化合物番号 1-87)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.90 (2H, s), 4.72 (2H, d,  $J=2.4$ ), 2.55 (1H, t,  $J=2.5$ ), 2.27 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.52 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 172-175°C)。

(実施例 4 5)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-プロパルギルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-88)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 4.79 (2H, d,  $J=2.6$ ), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 6)



ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5,5-ジメチル-1-プロパルギルオキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-90)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.79 (2H, d,  $J=2.2$ ), 2.97 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.58 (1H, t,  $J=2.6$ ), 2.23 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.58 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.5$ ).

物性: 油状物。

#### (実施例47)

5,5-ジメチル-1-シクロヘキシルメチルオキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-91)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 3.92-3.88 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.91-0.97 (11H, m), 1.47 (6H, s).

物性: 結晶 (融点: 195-197°C)。

#### (実施例48)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-シクロヘキシルメチルオキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-92)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 3.97 (2H, d,  $J=6.2$ ), 2.23 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.96-1.18 (11H, m), 1.47 (6H, s), 1.07 (9H, s).

物性: 油状物。

#### (実施例49)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5,5-ジメチル-1-シクロヘキシルメチルオキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-94)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.79 (2H, s), 3.97 (2H, d,  $J=6.23$ ), 2.97 (2H, q,  $J=7.3$ ),

2.22 (3H, s), 2.17 (6H, s), 2.30-1.00 (11H, m), 1.54 (6H, s), 1.16 (3H, t, J=7.3)。

物性：油状物。

(実施例 5 0)

5, 5-ジメチル-1-ベンジルオキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-95)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.47-7.35 (5H, m), 6.91 (2H, s), 6.21 (1H, brd. s), 5.12 (2H, s), 2.28 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.32 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 173-177°C)。

(実施例 5 1)

シクロヘキシルカルボン酸=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-106)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 2.39-2.30 (1H, m), 1.97-1.19 (10H, m)。

物性：油状物。

(実施例 5 2)

3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-112)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.52 (2H, s), 2.23 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.10 (6H, s)。

物性：油状物

(実施例 5 3)

炭酸=2, 2-ジメチルプロピル=エステル=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-123)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.67 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.54 (6H, s), 0.78 (9H, s)。

物性: 油状物。

#### (実施例 5 4)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-128)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.98 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性: 油状物。

#### (実施例 5 5)

ジチオ炭酸=S-イソプロピル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-130)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.49 (1H, septet,  $J=7.0$ ), 2.22 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.22 (6H, d,  $J=6.96$ )。

物性: 油状物。

#### (実施例 5 6)

ジチオ炭酸=S-フェニル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-134)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.47-7.28 (5H, m), 6.84 (2H, s), 5.04 (2H, s), 3.60 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.49 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 57)

5, 5-ジメチル-1-エトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-135)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 5.02 (2H, s), 3.82 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.27 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：結晶 (融点: 152-156°C)。

(実施例 58)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-136)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.08 (9H, s)。

物性：結晶 (融点: 75-76°C)。

(実施例 59)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-137)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.24 (3H, s), 2.20 (2H, s), 2.16 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.85 (9H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 60)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-エトキシメ

トキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-138)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.98 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.23 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.16 (3H, t,  $J=7.5$ ).

物性: 油状物。

(実施例 6 1)

5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-139)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 4.23-4.18 (2H, m), 3.68-3.63 (2H, m), 3.39 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.49 (6H, s).

物性: 結晶 (融点: 137-139°C)。

(実施例 6 2)

2, 2-ジメチルプロピオンickアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-140)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 4.28-4.32 (1H, m), 3.69-3.73 (1H, m), 3.43 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.07 (9H, s).

物性: 油状物。

(実施例 6 3)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号1-142)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.32-4.28 (2H, m), 3.73-3.69 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.97 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.22 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.16

(3H, t, J=7.5)。

物性：油状物。

(実施例 6 4)

5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-143)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.87 (2H, s), 5.06-5.05 (2H, m), 3.95-3.91 (2H, m), 3.59-3.55 (2H, m), 3.36 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.10 (6H, s), 1.47 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 6 5)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-144)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 5.14 (2H, s), 4.02-3.98 (2H, m), 3.64-3.40 (2H, m), 3.40 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：結晶 (融点：76-77°C)。

(実施例 6 6)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-146)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 5.14 (2H, s), 4.02-3.98 (2H, m), 3.64-3.60 (2H, m), 2.97 (2H, q, J=7.3), 2.22 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.16 (3H, t, J=7.3),。

物性：油状物。

(実施例 6 7)

5, 5-ジメチル-1-メチルチオメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-147)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 5.12-5.10 (2H, m), 2.32 (3Hs), 2.27 (3H, s), 2.10 (6H, s), 1.49 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 139-141°C)。

(実施例 6 8)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メチルチオメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-148)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 5.19 (2H, s), 2.36 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.09 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 6 9)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メチルチオメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 1-150)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 5.19 (3H, s), 2.98 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.37 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.55 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.5$ )。

物性: 油状物。

(実施例 7 0)

5, 5-ジメチル-1-(2, 2-ジメトキシエトキシ)-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-151)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.89 (2H, s), 4.75 (1H, td,  $J=2.0, 5.1$ ), 4.07 (2H, dd,

J=2.0, 5.1), 3.43 (6H, d, J=1.5), 2.26 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.50 (6H, s)。

物性：結晶（融点：96-98℃）。

(実施例 7 1)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(2, 2-ジメトキシエトキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-152)  
<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.82 (2H, s), 4.78 (1H, t, J=5.1), 4.14 (2H, d, J=5.1), 3.46 (6H, s), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：結晶（融点：79-80℃）。

(実施例 7 2)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-(2, 2-ジメトキシエトキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル]エステル(化合物番号1-154)  
<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.80 (2H, s), 4.78 (1H, t, J=5.1), 4.14 (2H, d, J=5.1), 3.46 (6H, s), 2.97 (2H, q, J=7.3), 2.22 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.16 (3H, t, J=7.3)。

物性：油状物。

(実施例 7 3)

5, 5-ジメチル-1-([1, 3]ジオキソラン-2-イルメトキシ)-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号1-155)  
<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.84 (2H, s), 5.24 (1H, t, J=4.2), 4.06 (2H, d, J=4.4), 4.07-3.81 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.07 (6H, s), 1.45 (6H, s)。

物性：結晶（融点：147-151℃）。

(実施例 7 4)



2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチルー1-([1, 3] ジオキソラン-2-イルメトキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-156)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 5.32 (1H, t,  $J=4.4$ ), 4.18 (2H, d,  $J=4.4$ ), 4.03-3.92 (4H, m), 2.23 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.08 (9H, s)。  
物性: 油状物。

(実施例 7 5)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチルー1-([1, 3] ジオキソラン-2-イルメトキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル(化合物番号1-158)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 5.31 (1H, t,  $J=4.4$ ), 4.18 (2H, d,  $J=4.4$ ), 4.06-3.89 (4H, m), 2.97 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.22 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.57 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性: 油状物。

(実施例 7 6)

5, 5-ジメチルー1-(テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ)-4-ヒドロキシー-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-オン(化合物番号1-159)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.87 (2H, s), 4.30-4.11 (1H, m), 4.10-3.98 (2H, m), 3.92-3.68 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.11 (6H, s), 2.10-1.53 (4H, m), 1.47 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 7 7)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチルー1-(テトラヒ

ドロフラン-2-イルメトキシ)-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-160)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 4.34-4.10 (3H, m), 3.95-3.75 (2H, m), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 2.10-1.70 (4H, m), 1.49 (6H, d,  $J=1.5$ ), 1.07 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 78)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-(ピリジン-3-イルメトキシ)-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-164)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.69 (1H, m), 8.62-8.61 (1H, m), 7.92-7.87 (1H, m), 7.37-7.30 (1H, m), 6.83 (2H, s), 5.19 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.32 (6H, s), 1.06 (9H, s)。

物性: 結晶(融点: 122-124℃)。

(実施例 79)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5,5-ジメチル-1-(ピリジン-3-イルメトキシ)-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル]エステル(化合物番号1-166)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.67 (1H, m), 8.61-8.59 (1H, m), 7.93-7.87 (1H, s), 7.37-7.30 (1H, m), 6.85 (2H, s), 5.18 (2H, s), 2.96 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.25 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.41 (6H, s), 1.15 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性: 油状物。

(実施例 80)

5,5-ジメチル-1-シアノメトキシ-4-ヒドロキシ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-オン(化合物番号1-167)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.93 (2H, s), 4.85 (2H, s), 2.29 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：結晶（融点：158-163℃）。

(実施例 8 1)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-シアノメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-168）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 4.90 (2H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.54 (6H, s), 1.08 (9H, s)。

物性：結晶（融点：117-120℃）。

(実施例 8 2)

5, 5-ジメチル-1-ベンジルオキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール（化合物番号 1-171）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.39-7.33 (5H, m), 6.91 (2H, s), 2.27 (3H, s), 6.40 (1H, brd.s), 5.14 (2H, s), 4.88 (2H, s), 2.27 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.52 (6H, s)。

物性：結晶（融点：85-87℃）。

(実施例 8 3)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ベンジルオキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-172）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.39-7.33 (5H, m), 6.83 (2H, s), 5.19 (2H, s), 4.90 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 8 4)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシメトキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-179)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.88 (2H, s), 5.07 (2H, s), 4.19 (2H, q,  $J=8.8$ ), 2.26 (3H, s), 2.09 (6H, s), 1.46 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 140-141°C)。

(実施例 85)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(3-クロロアリルオキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-192)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 6.35-6.23 (2H, m), 4.62 (2H, dd,  $J=0.7, 7.0$ ), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.07 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 86)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-アセトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-216)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 2.27 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.19 (2H, s), 2.17 (6H, s), 1.47 (6H, s), 0.83 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 117-118°C)。

(実施例 87)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ピバロイルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-218)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 2.23 (3H, s), 2.19 (2H, s), 2.18 (6H, s), 1.45 (6H, s), 1.38 (9H, s), 0.83 (9H, s)。

物性：結晶（融点：95-97℃）。

(実施例 8 8)

3, 3-ジメチルブテノイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ベンゾイルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-2 2 0）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.19-8.14 (2H, m), 7.65-7.46 (3H, m), 6.84 (2H, s), 2.24 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.21 (2H, s), 1.55 (6H, s), 0.84 (9H, s)。

物性：結晶（融点：102-107℃）。

(実施例 8 9)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(3, 3-ジメチルブテノイルオキシ)-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-2 2 2）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 2.43 (2H, s), 2.23 (3H, s), 2.19 (2H, s), 2.18 (6H, s), 1.47 (6H, s), 1.13 (9H, s), 0.83 (9H, s)。

物性：油状物

(実施例 9 0)

3, 3-ジメチルブテノイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ジメチルアミノカルボニルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-2 2 6）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 3.08 (3H, brd.s), 3.01 (3H, brd.s), 2.23 (3H, s), 2.18 (5H, s), 1.49 (6H, s), 0.83 (9H, s)。

物性：結晶（融点：160-163℃）。

(実施例 9 1)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メタンスルホニ

ルオキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-228)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 3.34 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.21 (2H, s), 2.15 (6H, s), 1.56 (6H, s), 0.84 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 9 2)

4-ヒドロキシ-1-メトキシ-8-メチル-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4. 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号1-275)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.92 (2H, s), 5.74 (1H, brd. s), 3.96 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.15 (6H, s), 2.30-1.51 (9H, m), 0.97 (3H, d,  $J=6.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 186-188°C)。

(実施例 9 3)

4-ヒドロキシ-1, 8-ジメトキシ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号1-279)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta$  (ppm): 11.30 (1H, s), 6.88 (2H, s), 3.80 (3H, s), 3.44-3.30 (1H, m), 3.25 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.03 (6H, s), 2.02-1.70 (8H, m)。

物性: 結晶 (融点: 162-163°C)。

(実施例 9 4)

5-エチル-5-メチル-1-メトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号1-299)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.91 (2H, s), 5.01 (2H, d,  $J=2.9$ ), 3.58 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.18 (3H, s), 2.14 (3H, s), 1.95-1.77 (2H, m), 1.51 (3H, s), 0.89 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性: 結晶 (融点: 157-159°C)。

(実施例 9 5)

5-イソプロピル-5-メチル-1-メトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-303)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.90 (2H, s), 5.02 (2H, s), 3.57 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.18 (3H, s), 2.12 (3H, s), 2.35-2.15 (1H, m), 1.56 (3H, s), 1.13 (3H, d, J=7.0), 1.00 (3H, d, J=7.0)。

物性: アモルファス。

(実施例 9 6)

5-ベンジル-5-メチル-1-メトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-311)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm): 11.39 (1H, s), 7.32-7.15 (5H, m), 6.77 (1H, s), 6.65 (1H, s), 5.04 (2H, ABq, J=7.3), 3.56 (3H, s), 3.08 (2H, ABq, J=13.6), 2.16 (3H, s), 1.98 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.15 (3H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例 9 7)

5, 5-ジエチル-1-メトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-315)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.92 (2H, s), 5.01 (2H, s), 3.56 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.95-1.77 (4H, m), 0.91 (6H, t, J=7.4)。

物性: 結晶 (融点: 147-149℃)。

(実施例 9 8)

4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 4, 6-ト

リメチルフェニル) - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 2 - オン (化合物番号 1 - 3 2 1)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta$  (ppm): 11.43 (1H, s), 6.87 (2H, s), 4.98 (2H, s), 3.47 (3H, s), 3.35-3.18 (1H, m), 3.25 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.13-1.70 (14H, m)。

物性: 結晶 (融点: 164-165°C)。

(実施例 99)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド = 1 - メトキシメトキシ - 2 - オキソ - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 4 - イル = エステル (化合物番号 1 - 3 8 9)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.07 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.30-0.74 (24H, m)。

物性: 油状物。

(実施例 100)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド = 5, 5 - ジメチル - 1 - メトキシメトキシ - 2 - オキソ - 3 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニル) - 2, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピロール - 4 - イル = エステル (化合物番号 1 - 3 9 0)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.65-1.56 (1H, m), 1.50 (6H, s), 1.08-0.80 (4H, m)。

物性: アモルファス。

(実施例 101)

1 - メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド = 5, 5 - ジメチル - 1 - メトキシメトキシ - 2 - オキソ - 3 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニル) - 2, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピロール - 4 - イル = エステル (化合物番号 1 - 3 9 1)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.24 (3H, s), 1.10-1.04 (2H, m), 0.75-0.65 (2H, m)。



物性：アモルファス。

(実施例 102)

2-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-392)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.75-1.60 (1H, m), 1.50 (3H, s), 1.38-1.26 (1H, m), 1.14-0.97 (4H, m), 0.73-0.64 (1H, m)。

物性：油状物。

(実施例 103)

1-メチル2,2-ジクロロシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-393)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (1H, s), 6.82 (1H, s), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.18 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.49-1.25 (5H, m)。

物性：油状物。

(実施例 104)

1-シアノシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-394)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.61-1.30 (10H, m)。

物性：結晶 (融点: 60-62℃)。

(実施例 105)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-395)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.23-3.10 (1H, m), 2.38-1.70 (15H, m), 1.49 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 106)

シクロペンタンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-396)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.32-2.04 (1H, m), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.95-1.07 (17H, m)。

物性: 油状物。

(実施例 107)

2-クロロアクリリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-397)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 6.53 (1H, brd.s), 6.08 (1H, brd.s), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 108)

2-クロロベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-398)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.01-7.96 (1H, m), 7.62-7.27 (3H, s), 6.83 (2H, s), 5.09

(2H, s), 3.63 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.21 (6H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 109)

2-メチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-  
2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-  
-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-399)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.85-7.81 (1H, m), 7.43-7.38 (1H, m), 7.28-7.19 (2H, m), 6.80 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.63 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.58 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 110)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-  
-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1  
H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-400)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.70-7.64 (1H, m), 7.55-7.45 (1H, m), 6.81 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.62 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.21 (3H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 101-102℃)。

(実施例 111)

3-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-  
-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1  
H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-401)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.57 (1H, d,  $J=7.6$ ), 7.44-7.32 (1H, m), 7.35 (1H, t,  $J=7.8$ ), 7.15-7.12 (1H, m), 6.80 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.62 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.57 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 102-104℃)。

(実施例 1 1 2)

4-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-402)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.91 (2H, d,  $J=8.8$ ), 6.89 (2H, d,  $J=8.8$ ), 6.79 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.85 (6H, s), 3.62 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.57 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 1 1 3)

2-トリフルオロメチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-403)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.75-7.52 (4H, m), 6.86 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.63 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.57 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 116-117°C)。

(実施例 1 1 4)

2,6-ジメチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-404)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.36 (1H, t,  $J=9.0$ ), 6.92 (2H, s), 6.62 (2H, d,  $J=9.0$ ), 5.03 (2H, s), 3.90 (6H, s), 3.60 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 141-145°C)。

(実施例 1 1 5)

3-メチル-2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メト

キシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-405)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.56 (1H, d,  $J=7.8$ ), 7.37 (1H, d,  $J=7.2$ ), 7.03 (1H, dd,  $J=7.8, 7.2$ ), 6.79 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.63 (3H, s), 3.39 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.18 (3H, s), 1.58 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 177-180°C)。

(実施例 116)

4-メチル-2-メトキシベンゾイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-406)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.61 (1H, d,  $J=7.8$ ), 6.80 (2H, s), 6.77-6.74 (1H, m), 5.07 (2H, s), 3.82 (3H, s), 3.62 (3H, s), 2.37 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.20 (3H, s), 1.55 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 115-118°C)。

(実施例 117)

3, 4, 5-トリメトキシベンゾイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-407)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.18 (2H, s), 6.81 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.90 (3H, s), 3.87 (6H, s), 3.63 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.20 (3H, s), 1.58 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 159-160°C)。

(実施例 118)

5-メチルクロマン-6-カルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-408)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.63 (1H, d,  $J=8.8$ ), 6.79 (1H, s), 6.67 (1H, d,  $J=8.8$ ),

5.08 (2H, s), 4.18-4.08 (2H, m), 3.62 (3H, s), 2.66-2.60 (2H, m), 2.20 (9H, s), 2.07-1.97 (2H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：結晶（融点：108-109℃）。

(実施例 1 1 9)

ベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキソール-5-カルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-409）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.57 (1H, dd,  $J=8.5, 1.5$ ), 7.34 (1H, d,  $J=1.5$ ), 6.82-6.80 (1H, m), 6.79 (2H, s), 6.03 (2H, s), 5.07 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.20 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 1 2 0)

シクロプロピルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-410）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 6.84 (2H, s), 5.10 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.64-1.55 (1H, m), 1.50 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.14-0.80 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例 1 2 1)

1-メチルシクロプロピルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 1-411）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 6.84 (2H, s), 5.10 (2H, s), 3.86 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.25 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.28 (3H, s), 1.39-1.24 (2H, m), 1.17-0.96

(2H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 1 2 2)

1-シアノシクロプロピルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-4 1 2)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.26 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.62-1.18 (13H, m)。

物性：油状物。

(実施例 1 2 3)

1-(4-エトキシフェニル)-2, 2-ジクロロシクロプロピルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-4 1 3)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.24-7.18 (2H, m), 6.88-6.80 (2H, m), 6.76 (1H, brd. s), 6.59 (1H, brd. s), 5.07 (2H, s), 4.06 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.83 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.45 (1H, d,  $J=7.7$ ), 2.20 (3H, s), 2.16 (3H, s), 1.98 (1H, d,  $J=7.7$ ), 1.74 (3H, s), 1.45 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.41 (3H, s), 1.38 (3H, s), 1.26 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：油状物。

(実施例 1 2 4)

シクロブチルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-4 1 4)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 5.10 (2H, s), 3.86 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.23-3.09 (1H, m), 2.38-1.37 (21H, m), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：油状物。

(実施例 1 2 5)

2-クロロアクリリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-415)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 6.52 (1H, d,  $J=1.5$ ), 6.08 (1H, d,  $J=1.5$ ), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.24 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.53 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 1 2 6)

2-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-416)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.85-7.81 (1H, m), 7.47-7.38 (1H, m), 7.27-7.19 (2H, m), 6.80 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.34 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 1 2 7)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-417)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.69-7.65 (1H, m), 7.54-7.45 (1H, m), 6.99-6.93 (2H, m), 6.81 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.84 (3H, s), 2.22 (9H, s), 1.56 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 結晶 (融点: 62-64°C)。

(実施例 1 2 8)



2-クロロベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-418)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.61-7.57 (1H, m), 7.46-7.43 (2H, m), 7.33-7.27 (1H, m), 6.83 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.22 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例129)

3-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-419)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.60-7.55 (1H, m), 7.45-7.43 (1H, m), 7.35 (1H, t,  $J=8.0$ ), 7.16-7.10 (1H, m), 6.80 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.82 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例130)

2-メチルチオベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-420)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.90 (1H, dd,  $J=8.0, 1.5$ ), 7.56-7.45 (1H, m), 7.25-7.10 (2H, m), 6.80 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.39 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.58 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 95-99°C)。

(実施例131)

3-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H

ーピロールー４－イル＝エステル（化合物番号１－４２１）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.79-7.75 (2H, m), 7.43-7.28 (2H, m), 6.79 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.38 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：油状物。

(実施例 1 3 2)

３－トリフルオロメチルベンゾイックアシッド＝１－エトキシメトキシ－５，５－ジメチルー２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロールー４－イル＝エステル（化合物番号１－４２２）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.19-8.12 (2H, m), 7.88-7.84 (1H, m), 7.64-7.56 (1H, m), 6.80 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：油状物。

(実施例 1 3 3)

３－シアノベンゾイックアシッド＝１－エトキシメトキシ－５，５－ジメチルー２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロールー４－イル＝エステル（化合物番号１－４２３）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.23-8.14 (2H, m), 7.88 (1H, dt,  $J=7.7, 1.5$ ), 7.60 (1H, dd,  $J=8.4, 7.7$ ), 6.81 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.20 (9H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：結晶（融点：124-125℃）。

(実施例 1 3 4)

３－クロロベンゾイックアシッド＝１－エトキシメトキシ－５，５－ジメチルー２－オキソ－３－（２，４，６－トリメチルフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロールー４－イル＝エステル（化合物番号１－４２４）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.92 (1H, t,  $J=1.8$ ), 7.84 (1H, dt,  $J=7.7, 1.5$ ),

7.60-7.55 (1H, m), 7.39 (1H, t, J=7.7), 6.80 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q, J=7.0), 2.20 (9H, s), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 1 3 5)

4-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-425)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.94-7.89 (2H, m), 6.92-6.88 (2H, m), 6.79 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q, J=7.0), 3.86 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.57 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 1 3 6)

4-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-426)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.85 (2H, d, J=8.4), 7.23 (2H, d, J=8.4), 6.78 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q, J=7.0), 2.40 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.18 (3H, s), 1.57 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 1 3 7)

4-クロロベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-427)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.91-7.85 (2H, m), 7.45-7.39 (2H, m), 6.79 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q, J=7.0), 2.20 (9H, s), 1.57 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 138)

2-トリフルオロメチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-428)。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.76-7.51 (3H, m), 7.26-7.24 (1H, m), 6.86 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.53 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 105-107°C)。

(実施例 139)

2-フェノキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-429)。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.73 (1H, dd,  $J=7.7, 1.8$ ), 7.47 (1H, dt,  $J=1.8, 7.7$ ), 7.37-7.27 (2H, m), 7.16-7.08 (2H, m), 6.92-6.88 (3H, m), 6.78 (2H, s), 5.09 (2H, s), 3.85 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.21 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.57 (6H, s), 1.27 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 油状物。

(実施例 140)

2-エトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-430)。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.61 (1H, dd,  $J=8.0, 1.8$ ), 7.46 (1H, dt,  $J=1.8, 8.0$ ), 7.00-6.88 (2H, m), 6.81 (2H, s), 5.13 (2H, s), 4.06 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.21 (9H, s), 1.57 (6H, s), 1.38 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 90-91°C)。

(実施例 1 4 1)

2-プロピルオキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-431)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.62 (1H, dd,  $J=8.0, 1.8$ ), 7.46 (1H, dt,  $J=1.8, 8.0$ ), 6.95-6.80 (2H, m), 5.13 (2H, s), 3.92 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.88 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.21 (9H, s), 1.85-1.68 (2H, m), 1.57 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.98 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 1 4 2)

ニコチニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-432)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 9.14 (1H, d,  $J=2.2$ ), 8.79-8.76 (1H, m), 8.20 (1H, dt,  $J=8.0, 2.2$ ), 7.43-7.36 (1H, m), 6.80 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.21 (6H, s), 2.19 (3H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 1 4 3)

4-トリフルオロメチルニコチニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-433)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.93 (1H, d,  $J=5.1$ ), 8.64 (1H, s), 7.64 (1H, d,  $J=5.1$ ), 6.86 (2H, s), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.25 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 1 4 4)

2-メチルチオ-4-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボキシリク  
アシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4,  
6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エス  
テル (化合物番号 1-434)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.62 (1H, s), 6.84 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.62 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 112-113°C)。

#### (実施例 145)

5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-  
カルボキシリクアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキ  
ソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロー  
ル-4-イル=エステル (化合物番号 1-435)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 5.12 (2H, s), 3.90 (3H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.22 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.54 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: アモルファス。

#### (実施例 146)

4-メチル-[1, 2, 3]チアジアゾール-5-カルボキシリクアシッド=  
1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリ  
メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化  
合物番号 1-436)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.82 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 154-158°C)。

#### (実施例 147)

ジメチルカルバミックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2

ーオキソー3ー(2, 4, 6ートリメチルフェニル)ー2, 5ージヒドロー1 Hー  
ピロールー4ーイル＝エステル (化合物番号1ー4 3 7)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 5.10 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.91 (3H, s), 2.74 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 92-93°C)。

(実施例1 4 8)

モルホリンー4ーカルボキシリクアシッド＝1ーエトキシメトキシー5, 5ー  
ジメチルー2ーオキソー3ー(2, 4, 6ートリメチルフェニル)ー2, 5ージヒ  
ドロー1 Hーピロールー4ーイル＝エステル (化合物番号1ー4 3 8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 5.10 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ),  
3.55-3.20 (8H, m), 2.26 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 88-89°C)。

(実施例1 4 9)

5, 5ージメチルー1ーエトキシメトキシー4ー(4ーメトキシベンジルオキシ)  
ー2ーオキソー3ー(2, 4, 6ートリメチルフェニル)ー2, 5ージヒドロー1  
Hーピロール (化合物番号1ー4 3 9)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.00-6.79 (6H, m), 5.06 (2H, s), 4.60 (2H, s), 3.85 (2H,  
q,  $J=7.0$ ), 3.79 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.47 (6H, s), 1.27 (3H,  
t,  $J=7.0$ )。

物性: 油状物。

(実施例1 5 0)

シクロプロピルカルボキシリクアシッド＝5, 5ージメチルー1ーメトキシエ  
トキシー2ーオキソー3ー(2, 4, 6ートリメチルフェニル)ー2, 5ージヒド  
ロー1 Hーピロールー4ーイル＝エステル (化合物番号1ー4 4 0)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 4.32-4.26 (2H, m), 3.73-3.68 (2H, m), 3.43

(3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.65-1.39 (7H, m), 0.89-0.79 (4H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 1 5 1)

1-メチルシクロプロピルカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-441)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 4.32-4.26 (2H, m), 3.73-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.23 (3H, s), 1.10-1.03 (2H, m), 0.77-0.64 (2H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 1 5 2)

1-シアノシクロプロピルカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-442)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 4.33-4.10 (2H, m), 3.73-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.60-1.30 (10H, m)。

物性：油状物。

(実施例 1 5 3)

シクロブチルカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-443)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 4.32-4.27 (2H, m), 3.74-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 3.22-3.09 (1H, m), 2.38-1.76 (15H, m), 1.49 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 1 5 4)



2-クロロアクリリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-444)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 6.52 (1H, d,  $J=1.8$ ), 6.07 (1H, d,  $J=1.8$ ), 4.34-4.29 (2H, m), 3.74-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.54 (6H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例155)

2-メチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-445)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.84-7.79 (1H, m), 7.43-7.38 (1H, m), 7.27-7.19 (2H, m), 6.80 (2H, s), 4.36-4.30 (2H, m), 3.76-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.58 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例156)

2-メチルチオベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号1-446)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.92-7.88 (1H, m), 7.49-7.46 (1H, m), 7.26-7.11 (2H, m), 6.80 (2H, s), 4.33 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.81 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.44 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.23 (6H, s), 2.20 (3H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 112-115°C)。

(実施例157)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1

H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-447)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.66 (1H, dd,  $J=8.1, 1.8$ ), 7.50 (1H, td,  $J=8.1, 1.8$ ), 6.98-6.91 (2H, m), 6.81 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.84 (3H, s), 3.73 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.44 (3H, s), 2.22 (9H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 158)

2-プロモベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-448)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.66-7.62 (1H, m), 7.52-7.48 (1H, m), 7.36-7.31 (2H, m), 6.84 (2H, s), 4.36-4.31 (2H, m), 3.76-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.60 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 60-63°C)。

(実施例 159)

2-ニトロベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-449)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.03-7.99 (1H, m), 7.82-7.60 (2H, m), 7.03-6.99 (1H, m), 6.88 (2H, s), 4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.70 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.61 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 160)

2-トリフルオロメチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-450)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.75-7.51 (3H, m), 7.26-7.24 (1H, m), 6.85 (2H, s),

4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.58 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 1 6 1)

2-メチルスルフィニルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-451)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.26 (1H, dd,  $J=8.1, 1.1$ ), 8.09 (1H, dd,  $J=8.1, 1.1$ ), 7.87 (1H, td,  $J=7.3, 1.5$ ), 7.60 (1H, td,  $J=7.3, 1.1$ ), 6.87-6.72 (2H, m), 4.36-4.313 (2H, m), 3.75-3.68 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.13 (3H, s), 1.63 (3H, s), 1.57 (3H, s)。

物性：ガム状。

(実施例 1 6 2)

2-メチルスルホニルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-452)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.11-8.06 (1H, m), 7.70-7.57 (2H, m), 7.09-7.04 (1H, m), 6.90 (2H, s), 4.36-4.11 (2H, m), 3.76-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 3.21 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.24 (6H, s), 1.63 (6H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 1 6 3)

2-フェノキシメチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-453)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.94 (1H, dd,  $J=7.9, 1.3$ ), 7.73 (1H, d,  $J=7.7$ ), 7.58 (1H, t,  $J=7.0$ ), 7.41-7.24 (3H, m), 6.96 (1H, t,  $J=7.3$ ), 6.83 (2H, dd,  $J=9.0$ ,

1.1), 6.77 (2H, s), 5.07 (2H, s), 4.35-4.31 (2H, m), 3.75-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.19 (6H, s), 2.10 (3H, s), 1.59 (6H, s)。

物性：結晶（融点：66-68℃）。

(実施例 164)

2-メトキシカルボニルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号1-454）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.80-7.75 (1H, m), 7.58-7.44 (2H, m), 7.18-7.13 (1H, m), 6.86 (2H, s), 4.36-4.31 (2H, m), 3.80 (3H, s), 3.76-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.62 (6H, s)。

物性：結晶（融点：146-149℃）。

(実施例 165)

2-フェノキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号1-455）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.73 (1H, dd,  $J=7.9, 1.65$ ), 7.51-7.26 (3H, m), 7.16-7.09 (2H, m), 6.90 (3H, d,  $J=8.8$ ), 6.77 (2H, s), 4.28 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.69 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.41 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.42 (6H, s)。

物性：結晶（融点：115-116℃）。

(実施例 166)

2-エトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号1-456）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.61 (1H, dd,  $J=8.1, 1.8$ ), 7.46 (1H, td,  $J=8.1, 1.8$ ), 6.95-6.88 (2H, m), 6.81 (2H, s), 4.35-4.30 (2H, m), 4.06 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.75-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.57 (6H, s), 1.38 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：結晶（融点：89-91℃）。

(実施例 1 6 7)

2-プロピルオキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号1-457）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.62 (1H, dd,  $J=8.1, 1.8$ ), 7.50-7.41 (1H, m), 6.95-6.88 (2H, m), 6.80 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.94 (2H, t,  $J=6.4$ ), 3.73 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.44 (3H, s), 2.21 (9H, s), 1.77 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.57 (6H, s), 0.98 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：結晶（融点：94-96℃）。

(実施例 1 6 8)

2-アセトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号1-458）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.88 (1H, dd,  $J=8.1, 1.8$ ), 7.59 (1H, td,  $J=8.1, 1.8$ ), 7.34-7.31 (1H, m), 7.08 (1H, d,  $J=7.3$ ), 6.81 (2H, s), 4.34-4.30 (2H, m), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.19 (9H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：結晶（融点：105-107℃）。

(実施例 1 6 9)

2-メチルニコチニックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号1-459）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 8.64 (1H, dd,  $J=4.8, 1.8$ ), 8.08 (1H, dd,  $J=8.1, 1.8$ ), 7.28-7.20 (1H, m), 6.82 (2H, s), 4.37-4.33 (2H, m), 3.77-3.72 (2H, m), 3.45 (3H, s), 2.59 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.60 (6H, s)。

物性：結晶（融点：73-74℃）。

(実施例 170)

4-トリフルオロメチルニコチンクアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-460)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.93 (1H, d,  $J=5.2$ ), 8.63 (1H, s), 7.64 (1H, d,  $J=5.2$ ), 6.86 (2H, s), 4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.58 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 102-104°C)。

(実施例 171)

2-メチルチオ-4-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-461)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 8.62 (1H, s), 6.84 (2H, s), 4.33 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.72 (2H, t,  $J=4.6$ ), 3.44 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.57 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 118-120°C)。

(実施例 172)

5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号1-462)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 4.34-4.30 (2H, m), 3.90 (3H, s), 3.74-3.70 (2H, s), 3.43 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.05 (6H, s), 1.55 (6H, s)。

物性: ガム状。

(実施例 173)

4-メチル- [1, 2, 3] チアジアゾール-5-カルボキシリクアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1-463)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 4.35-4.31 (2H, m), 3.74-3.70 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.83 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.57 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 72-74°C)。

(実施例 174)

5, 5-ジメチル-4-ベンジルオキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-464)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.31-7.26 (3H, m), 7.05-7.02 (2H, m), 6.86 (2H, s), 4.67 (2H, s), 4.24 (2H, t, J=4.8), 3.69 (2H, t, J=4.6), 3.42 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.10 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 175)

5, 5-ジメチル-4-(4-メトキシベンジルオキシ)-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1-465)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.97 (2H, d, J=8.8), 6.87 (2H, s), 6.81 (2H, d, J=8.8), 4.59 (2H, s), 4.25-4.21 (2H, m), 3.79 (3H, s), 3.71-3.66 (2H, m), 3.41 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.61 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 176)

5, 5-ジメチル-4-エトキシメトキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ

—3—(2, 4, 6—トリメチルフェニル)—2, 5—ジヒドロ—1H—ピロール  
(化合物番号1—466)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.72 (2H, s), 4.27–4.22 (2H, m), 3.77–3.67 (2H, m), 3.59 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.42 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.16 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 油状物。

(実施例177)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5—ジメチル—1—メトキシ—2—オキソ—3—(2, 4, 6—トリメチルフェニル)—2, 5—ジヒドロ—1H—ピロール—4—イル=エステル (化合物番号1—467)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 3.99 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.68–1.54 (1H, m), 1.50 (6H, s), 0.95–0.78 (4H, m)。

物性: 結晶 (融点: 86–87°C)。

(実施例178)

5—アリル—4—ヒドロキシ—5—メチル—1—メトキシメトキシ—2—オキソ—3—(2, 4, 6—トリメチルフェニル)—2, 5—ジヒドロ—1H—ピロール (化合物番号1—468)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta$  (ppm): 11.34 (1H, s), 6.84 (2H, s), 5.72–5.55 (1H, m), 5.16–5.04 (2H, m), 4.90 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 3.47 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.03 (6H, s), 1.41 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 128–130°C)。

(実施例179)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5—アリル—5—メチル—1—メトキシメトキシ—2—オキソ—3—(2, 4, 6—トリメチルフェニル)—2, 5—ジヒドロ—1H—ピロール—4—イル=エステル (化合物番号1—469)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 5.85–5.68 (1H, m), 5.23–5.11 (2H, m), 5.06



(2H, s), 3.61 (3H, s), 2.70 (1H, dd, J=14.3, 6.6), 2.51 (1H, dd, J=14.3, 7.7), 2.24 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.71-1.51 (1H, m), 1.52 (3H, s), 0.92-0.77 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例 180)

5-シクロヘキシルメチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 1-470)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm): 11.34 (1H, s), 6.86 (1H, s), 4.87 (2H, ABq, J=7.3), 3.46 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.20-2.18 (2H, m), 2.09 (3H, s), 2.02 (3H, s), 1.81-0.80 (14H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 181)

4-ヒドロキシ-5-(2-フェニルエチル)-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 1-471)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 11.53 (1H, s), 7.33-7.15 (5H, m), 6.88 (2H, s), 4.95 (2H, ABq, J=7.7), 3.48 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.11 (3H, s), 2.07 (3H, s), 2.68-1.91 (4H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 182)

5-(3-ブテニル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 1-472)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.87 (2H, s), 5.91-5.73 (1H, m), 5.08-4.87 (4H, m), 3.56 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.12 (3H, s), 2.03-1.84 (4H, m), 1.51

(3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 183)

4-ヒドロキシ-5-メチル-5-メトキシエチル-1-メトキシメトキシ-  
2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-  
-ピロール (化合物番号 1-473)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm): 11.44 (1H, s), 6.86 (2H, s), 4.88 (2H, ABq, J=7.3),  
3.50 (3H, s), 3.18 (3H, s), 2.26-1.91 (13H, m), 1.41 (3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 184)

4-ヒドロキシ-5-メチル-5-メトキシエトキシエチル-1-メトキシメ  
トキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒド  
ロ-1H-ピロール (化合物番号 1-474)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.89 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.74-3.68 (2H, m), 3.59-3.51  
(7H, m), 3.38 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.98 (3H, t, J=7.0), 1.53  
(3H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 185)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニ  
ル)-1-アザスピロ[4.4]ノナン-3-エン-2-オン (化合物番号 1-4  
75)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.91 (2H, s), 5.04 (2H, s), 3.58 (3H, s), 2.28 (3H, s),  
2.14 (6H, s), 2.28-1.85 (8H, m)。

物性：結晶 (融点: 149-151℃)。

(実施例 186)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-1)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 10.1 (1H, brd. s), 7.41-7.40 (1H, m), 7.26-7.24 (2H, m), 1.45 (6H, s), 1.19 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 178-179°C)。

(実施例187)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号2-2)

$^1\text{H-NMR}(\text{CD}_3\text{OD}) \delta$  (ppm): 7.52 (1H, d,  $J=2.0$ ), 7.40-7.25 (2H, m), 3.92 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 199-201°C)。

(実施例188)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-3)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.40 (1H, brd. s), 7.29 (2H, brd. s), 4.00 (3H, s), 1.49 (2H, s), 1.20 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例189)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-エトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号2-5)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta$  (ppm): 7.62 (1H, d,  $J=1.1$ ), 7.41 (1H, m), 7.29 (1H, d,  $J=8.1$ ), 4.02 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.38 (6H, s), 1.22 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 170-172°C)。

(実施例 190)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-エトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-6)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.41 (1H, m), 7.30-7.26 (2H, m), 4.22 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.51 (6H, s) 1.35 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.20 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 191)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.65 (1H, d,  $J=1.8$ ), 7.43 (1H, dd,  $J=8.4, 2.2$ ), 7.31 (1H, brd.s), 4.89 (2H, s), 3.47 (3H, s), 1.40 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 148-150°C)。

(実施例 192)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-9)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.40 (1H, m), 7.29 (2H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.49 (6H, s), 1.24 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 193)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-11)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.64 (1H, d,  $J=1.8$ ), 7.42 (1H, dd,  $J=8.1, 2.2$ ), 7.29 (1H,

d,  $J=8.4$ ), 4.93 (2H, s), 3.75 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.39 (6H, s), 1.17 (3H, t,  $H=7.0$ )。

物性：結晶（融点：166-168℃）。

(実施例 194)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-12)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.40 (1H, m), 7.29-7.28 (2H, m), 5.10 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.56 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.20 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 195)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 2-14)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta$  (ppm): 11.86 (1H, s), 7.64 (1H, d,  $J=1.8$ ), 7.43 (1H, dd,  $J=6.2, 1.8$ ), 7.28 (1H, d,  $J=6.2$ ), 4.09 (2H, dd,  $J=4.4, 1.8$ ), 3.57 (2H, dd,  $J=4.4, 1.8$ ), 3.23 (3H, s), 1.39 (6H, s)。

物性：結晶（融点：139.0-139.5℃）。

(実施例 196)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 2-18)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.23 (1H, brd. s), 4.49 (1H, s), 4.04 (3H, s), 2.33 (3H, s), 1.55 (3H, s), 1.51 (3H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 197)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-19)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 7.24-7.20 (2\text{H}, \text{m}), 7.10-7.06 (1\text{H}, \text{m}), 4.00 (3\text{H}, \text{s}), 2.32 (3\text{H}, \text{s}), 1.48 (6\text{H}, \text{s}), 1.18 (9\text{H}, \text{s})$ 。

物性：油状物。

(実施例198)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号2-20)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 7.20-7.16 (2\text{H}, \text{m}), 7.09-7.04 (1\text{H}, \text{m}), 4.01 (3\text{H}, \text{s}), 3.03 (2\text{H}, \text{q}, J=7.3), 2.30 (3\text{H}, \text{s}), 1.55 (6\text{H}, \text{s}), 1.23 (3\text{H}, \text{t}, J=7.3)$ 。

物性：油状物。

(実施例199)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-エトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-22)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 7.24-7.19 (2\text{H}, \text{m}), 7.10-7.05 (1\text{H}, \text{m}), 4.21 (2\text{H}, \text{q}, J=7.3), 2.32 (3\text{H}, \text{s}), 1.47 (6\text{H}, \text{s}), 1.36 (3\text{H}, \text{t}, J=7.3), 1.18 (9\text{H}, \text{s})$ 。

物性：結晶 (融点：103-104℃)。

(実施例200)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-エトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号2-23)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 7.20-7.16 (2\text{H}, \text{m}), 7.09-7.03 (1\text{H}, \text{m}), 4.22 (2\text{H}, \text{q}, J=7.0), 3.04 (2\text{H}, \text{q}, J=7.7), 2.30 (3\text{H}, \text{s}), 1.54 (6\text{H}, \text{s}), 1.37 (3\text{H}, \text{t}, J=7.0), 1.24$

(3H, t, J=7.7)。

物性：油状物。

(実施例 2 0 1)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-24)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.27-7.24 (1H, m), 7.06-7.00 (2H, m), 5.11 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.33 (3H, s), 1.53 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 153-158℃)。

(実施例 2 0 2)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-25)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.26-7.24 (1H, m), 7.20 (1H, brd. s), 7.11-7.06 (1H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.32 (3H, s), 1.48 (6H, s), 1.19 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 2 0 3)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 2-26)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.20-7.16 (2H, m), 7.09-7.04 (1H, m), 5.06 (2H, s), 3.63 (3H, s), 3.03 (2H, q, J=7.7), 2.30 (3H, s), 1.55 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.7)。

物性：油状物。

(実施例 2 0 4)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 6

ージメチルー４－ブロモフェニル)－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール (化合物番号２－３４)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.25 (2H, s), 6.20 (1H, brd. s), 3.95 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：234-235℃)。

(実施例 205)

５，５－ジメチル－４－ヒドロキシ－１－メトキシメトキシ－２－オキソ－３－(４－ブロモ－２，６－ジメチルフェニル)－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール (化合物番号２－４０)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.26 (2H, s), 4.99 (2H, s), 3.58 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.50 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：183-185℃)。

(実施例 206)

５，５－ジメチル－４－ヒドロキシ－１－メトキシエトキシ－２－オキソ－３－(４－ブロモ－２，６－ジメチルフェニル)－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール (化合物番号２－４６)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.27 (2H, s), 4.11 (2H, t, J=4.4), 3.60 (2H, t, J=4.4), 3.36 (3H, s), 2.02 (6H, s), 1.39 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：161-162℃)。

(実施例 207)

５，５－ジメチル－４－ヒドロキシ－１－メトキシ－２－オキソ－３－(２，３－ジメチルフェニル)－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール (化合物番号２－５０)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.15-7.07 (2H, m), 4.06 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：167-168℃)。



(実施例 208)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-66)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.06-6.94 (3H, m), 4.00 (3H, s), 3.63 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.23 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 209)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-82)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.14-7.00 (3H, m), 6.15 (1H, brd. s), 3.96 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 49-50°C)。

(実施例 210)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-88)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.15 (1H, d, J=7.8), 7.07 (1H, d, J=7.8), 6.99 (1H, s), 6.50 (1H, bs), 5.01 (2H, s), 3.60 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 121-122°C)。

(実施例 211)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-89)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.09-7.00 (2H, m), 6.88 (1H, s), 5.04 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.47 (6H, s), 1.11 (9H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 2 1 2)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-98)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.21-7.04 (3H, s), 3.72 (3H, s), 2.19 (6H, s), 152 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 2 1 3)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-104)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.0-7.2 (3H, m), 4.99 (2H, s), 3.58 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 154-155°C)。

(実施例 2 1 4)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-105)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.95-7.15 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.06 (9H, s)。

物性：結晶 (融点: 82-83°C)。

(実施例 2 1 5)

1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-107)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.20-7.05 (3H, m), 6.47 (1H, brd. s), 5.06 (2H, s), 3.85 (2H, q,  $J=7.2$ ), 2.17 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.2$ )。

物性：結晶（融点：122-123℃）。

(実施例 2 1 6)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-108)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.13-6.98 (3H, m), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=6.9$ ), 2.20 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=6.9$ ), 1.06 (9H, s)。

物性：結晶（融点：119-120℃）。

(実施例 2 1 7)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール (化合物番号 2-110)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.16-7.02 (3H, m) 4.26-4.16 (2H, m) 3.72-3.62 (2H, m) 3.40 (3H, s) 2.15 (6H, s) 1.50 (6H, s)。

物性：結晶（融点：107-109℃）。

(実施例 2 1 8)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-111)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.15-6.95 (3H, m) 4.35-4.27 (2H, m) 3.75-3.68 (2H, m) 3.43 (3H, s) 2.20 (6H, s) 1.50 (6H, s) 1.05 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 2 1 9)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル]エステル(化合物番号2-112)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.13-6.93 (3H, m) 4.33-4.28 (2H, m) 3.73-3.68 (2H, m) 3.43 (3H, s) 2.96 (2H, q, J=7.3) 2.21 (6H, s) 1.58 (6H, s) 1.15 (3H, t, J=7.3)。

物性: 油状物。

(実施例220)

5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-4-ブロモフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号2-114)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.41-7.26 (2H, m), 6.87-6.81 (1H, m), 4.06 (3H, s), 2.36 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性: 結晶(融点: 193-194℃)。

(実施例221)

5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号2-136)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.05-7.25 (3H, m), 4.97 (2H, s), 3.57 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.48 (3H, s)。

物性: 結晶(融点: 169-171℃)。

(実施例222)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-ブロモフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号2-137)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.07-7.25 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.30 (3H, s), 1.55 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.11 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 2 2 3)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-クロルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-142)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.25-7.00 (3H, m), 4.25-4.17 (2H, m), 3.72-3.62 (2H, m), 3.41 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.49 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 137-140°C)。

(実施例 2 2 4)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-152)。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.42-7.38 (1H, m), 7.13-7.05 (2H, m), 4.95 (2H, s), 3.56 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 145-147°C)。

(実施例 2 2 5)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-153)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.39-7.36 (1H, m), 7.17-7.03 (2H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.32 (3H, s), 1.56 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.12 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 2 2 6)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合

物番号 2-158)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.50-7.38 (1H, m), 7.18-7.05 (2H, m), 4.23-4.19 (2H, m), 3.72-3.64 (2H, m), 3.40 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.48 (3H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例 227)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-162)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.82-6.68 (3H, m), 4.06 (3H, s), 3.78 (3H, s), 2.34 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 228)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-4-フェニルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-オン (化合物番号 2-178)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.60-7.29 (8H, m), 4.05 (3H, s), 2.35 (3H, s), 1.50 (3H, s), 1.49 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 193-194°C)。

(実施例 229)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-4-フェニルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-194)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.70-7.63 (2H, m), 7.52-7.40 (3H, m), 7.36 (2H, s), 3.84 (3H, s), 2.50 (6H, s), 1.44 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 143-145°C)。

(実施例 2 3 0)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-4-シアノフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール  
(化合物番号 2-216)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.24 (2H, s), 4.99 (2H, s), 3.58 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 152-154°C)。

(実施例 2 3 1)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-4-シアノフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-217)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.31 (2H, s), 5.04 (2H, s), 3.60 (3H, s), 2.23 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.08 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 2 3 2)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-232)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.06 (1H, d,  $J=7.7$ ), 6.99 (1H, d,  $J=7.7$ ), 5.01 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.53 (3H, s), 1.52 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 178-180°C)。

(実施例 2 3 3)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-233)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.00 (1H, d,  $J=7.7$ ), 6.91 (1H, d,  $J=7.7$ ), 5.07 (2H, s), 3.63 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.16 (3H, s), 2.10 (3H, s), 1.51 (6H, s), 1.06 (9H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 79-82°C)。

(実施例 2 3 4)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-238)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.02 (1H, d,  $J=7.7$ ), 6.95 (1H, d,  $J=7.7$ ), 4.25-4.15 (2H, m), 3.70-3.60 (2H, m), 3.39 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.10 (3H, s), 2.06 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 2 3 5)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-239)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.98 (1H, d,  $J=7.7$ ), 6.89 (1H, d,  $J=7.7$ ), 4.33-4.27 (2H, m), 3.73-3.67 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.20 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.09 (3H, s), 1.50 (6H, s), 1.04 (9H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 2 3 6)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-242)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.93 (1H, s), 3.97 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.16 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.53 (6H, s)。



物性：結晶（融点：182-185℃）。

(実施例 2 3 7)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号2-243)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (1H, s), 4.00 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.12 (9H, s), 1.49 (6H, s), 1.05 (9H, s)。

物性：結晶（融点：104-106℃）。

(実施例 2 3 8)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号2-248)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.88 (1H, s), 6.71 (1H, brd. s), 4.94 (2H, s), 3.55 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.06 (6H, s), 1.48 (3H, s), 1.47 (3H, s)。

物性：結晶（融点：175-176℃）。

(実施例 2 3 9)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号2-254)  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.89 (1H, s), 4.19 (2H, t, J=4.6), 3.64 (2H, t, J=4.6), 3.38 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.07 (6H, s), 1.50 (3H, s), 1.49 (3H, s)。

物性：結晶（融点：144-146℃）。

(実施例 2 4 0)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-

(2, 4, 6-トリメチル-3-クロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-264)

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.60 (1H, s), 7.08 (1H, s), 4.89 (2H, s), 3.48 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.03 (3H, s), 1.48 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 188-189°C)。

(実施例 241)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジクロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-279)

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  (ppm): 7.48 (1H, d, J=2.3), 7.35 (1H, d, J=8.3), 7.28 (1H, dd, J=8.3, 2.3), 6.65 (1H, bs), 5.01 (2H, s), 3.61 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 158-160°C)。

(実施例 242)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジクロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-281)

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  (ppm): 7.39-7.35 (2H, m), 7.28-7.14 (1H, m), 5.02 (2H, s), 3.60 (3H, s), 1.54 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 183-185°C)。

(実施例 243)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジクロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-282)

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  (ppm): 7.36-7.31 (2H, m), 7.24-7.16 (1H, m), 5.07 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.52 (6H, s), 1.18 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 87-88°C)。

(実施例 2 4 4)

1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-284)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.39-7.34 (2H, m), 7.27-7.16 (1H, m), 5.07 (2H, s), 3.85 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.53 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 結晶 (融点: 170-171°C)。

(実施例 2 4 5)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-285)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.36-7.31 (2H, m), 7.24-7.16 (1H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.52 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.17 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 134-135°C)。

(実施例 2 4 6)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,5-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-298)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.33-7.22 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.49 (6H, s), 1.20 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 133-136°C)。

(実施例 2 4 7)

5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(3,5-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-307)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ ): 8.04 (2H, m), 7.37 (1H, m), 3.82 (3H, s), 1.40 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 197-199°C)。

(実施例 248)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシ-2-オキソ-3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-308)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.52 (2H, d,  $J=1.8$ ), 7.30 (1H, t,  $J=1.8$ ), 4.00 (3H, s), 1.44 (6H, s), 1.33 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 249)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-313)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 8.03 (1H, t,  $J=1.5$ ), 7.39 (1H, t,  $J=1.5$ ), 4.91 (2H, s), 3.49 (3H, s), 1.41 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 202-203°C)。

(実施例 250)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-314)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.51 (2H, d,  $J=1.8$ ), 7.30 (1H, t,  $J=1.8$ ), 5.04 (2H, s), 3.63 (3H, s), 1.44 (6H, s), 1.33 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 251)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-

(2-クロロ-6-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-329)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.56 (1H, dd,  $J=7.0, 1.1$ ), 7.53 (1H, dd,  $J=7.0, 1.1$ ), 7.30 (1H, t,  $J=7.0$ ), 4.89 (2H, s), 3.45 (3H, s), 1.41 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 177-178°C)。

(実施例 252)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-330)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.51 (1H, dd,  $J=8.1, 1.1$ ), 7.38 (1H, dd,  $J=8.1, 1.1$ ), 7.13 (1H, t,  $J=8.1$ ), 5.07 (2H, s), 3.63 (3H, s), 1.53 (3H, s), 1.52 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 86-87.5°C)。

(実施例 253)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-345)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.62 (1H, d,  $J=8.1$ ), 7.41-7.35 (2H, m), 7.26-7.20 (1H, m), 6.33 (1H, brd. s), 5.02 (2H, s), 3.61 (3H, s), 1.53 (6H, s)。

(実施例 254)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-346)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.56 (1H, d,  $J=7.9$ ), 7.32-7.28 (2H, m), 7.21-7.15 (1H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.15 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 83-85°C)。

(実施例 2 5 5)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-371)

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm): 12.10 (1H, brd. s), 7.97 (2H, s), 3.83 (3H, s), 1.43 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 242-244°C)。

(実施例 2 5 6)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-377)

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.64 (2H, s), 5.02 (2H, s), 3.60 (3H, s), 1.55 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 170-171°C)。

(実施例 2 5 7)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-378)

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.59 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.53 (6H, s), 1.20 (9H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例 2 5 8)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-380)

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.53 (2H, s), 5.15 (2H, s), 3.84 (2H, q, J=7.0), 1.58

(6H, s), 1.28 (3H, t, J=7.0)。

物性：アモルファス。

(実施例 2 5 9)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-393)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.37 (2H, s), 7.21 (1H, bs), 4.98 (2H, s), 3.58 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 194-195°C)。

(実施例 2 6 0)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-425)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.45-7.36 (2H, m), 7.36-7.24 (2H, m), 5.00 (2H, s), 3.60 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性：結晶 (融点: 174-176°C)。

(実施例 2 6 1)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-426)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.36-7.26 (4H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.49 (6H, s), 1.17 (9H, s)。

物性：結晶 (融点: 78-80°C)。

(実施例 2 6 2)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシメ

トキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 2-427)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.39-7.22 (4H, m), 5.06 (2H, s), 3.63 (3H, s), 3.02 (2H, q,  $J=7.3$ ), 1.56 (6H, s), 1.22 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 結晶 (融点: 75-79°C)。

(実施例 263)

1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-428)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.42-7.10 (4H, m), 5.14 (2H, s), 4.99 (1H, brd. s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.53 (6H, s), 1.27 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 119-122°C)。

(実施例 264)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-429)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.22 (4H, m), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.49 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.17 (9H, s).

物性: 結晶 (融点: 109-112°C)。

(実施例 265)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 2-430)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.39-7.22 (4H, m), 5.12 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.02 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.56 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.22 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。



(実施例 2 6 6)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-4 3 1)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.42-7.10 (4H, s), 4.45-4.30 (2H, m), 3.75-3.63 (2H, m), 3.42 (3H, s), 1.56 (3H, s), 1.53 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 131-134°C)。

(実施例 2 6 7)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-4 3 2)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.20 (4H, m), 4.33-4.27 (2H, m), 3.75-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 1.50 (6H, s), 1.17 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 2 6 8)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 2-4 3 3)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.34-7.22 (4H, m), 4.34-4.30 (2H, m), 3.74-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 3.02 (2H, q, J=7.3), 1.57 (6H, s), 1.22 (3H, t, J=7.3)。

物性: 油状物。

(実施例 2 6 9)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-4 4 6)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.47 (1H, d,  $J=7.8$ ), 7.36-7.31 (1H, m), 7.26-7.25 (1H, m), 5.01 (2H, s), 3.61 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：結晶（融点：162-163°C）。

(実施例 270)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジブロモフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号2-447）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.45-7.26 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.53 (3H, brd. s), 1.45 (3H, brd. s), 1.19 (9H, s)。

物性：結晶（融点：140-143°C）。

(実施例 271)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール（化合物番号2-473）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.11 (2H, s), 6.94 (1H, s), 5.02 (2H, s), 2.33 (6H, s), 1.46 (6H, s)。

物性：結晶（融点：164-165°C）。

(実施例 272)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(3-クロロ-2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール（化合物番号2-479）。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.23 (1H, d,  $J=8.1$ ), 6.97 (1H, d,  $J=8.1$ ), 4.96 (2H, s), 3.57 (3H, s), 2.18 (3H, s), 2.09 (3H, s), 1.49 (6H, s)。

物性：結晶（融点：182-184°C）。

(実施例 273)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール  
(化合物番号2-503)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.29 (1H, s), 7.00 (1H, s), 5.02 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.51 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 148-150°C)。

(実施例274)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-504)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.21 (1H, s), 6.97 (1H, s), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.26 (6H, s), 1.55 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.14 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例275)

1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール  
(化合物番号2-505)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.25 (1H, s), 6.96 (1H, s), 5.01 (2H, s), 3.81 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.27 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.27 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 173-178°C)。

(実施例276)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-ブロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-506)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.20 (1H, s), 6.97 (1H, s), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q,

J=7.0), 2.26 (6H, s), 1.54 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0), 1.13 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 277)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール  
(化合物番号 2-507)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.23 (1H, s), 6.94 (1H, s), 4.25-4.15 (2H, m), 3.70-3.60 (2H, m), 3.37 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.15 (3H, s), 1.49 (3H, s), 1.46 (3H, s)。

物性：結晶 (融点 : 134-138°C)。

(実施例 278)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-508)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.20 (1H, s), 6.96 (1H, s), 4.35-4.26 (2H, m), 3.75-3.66 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.26 (6H, s), 1.55 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.13 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 279)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロ-6-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール  
(化合物番号 2-509)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.25 (1H, brd. s), 7.12 (1H, brd. s), 4.96 (2H, s), 3.57 (3H, s), 2.17 (3H, s), 1.49 (3H, s), 1.47 (3H, s)。

物性：結晶 (融点 : 173-175°C)。

(実施例 280)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロ-6-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-510)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.23 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.13 (1H, m), 5.04 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.53 (6H, s), 1.23 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 281)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロ-6-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-513)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.18 (1H, brd. s), 7.11 (1H, m), 4.22-4.17 (2H, m), 3.72-3.59 (2H, m), 3.42 (3H, s), 2.18 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.46 (3H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例 282)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-ブロモ-5-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-527)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.55-7.10 (3H, m), 5.00 (2H, s), 3.60 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.50 (3H, s)。

物性: 結晶 (融点: 170-174°C)。

(実施例 283)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-528)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.33-7.15 (2H, m), 7.10-6.93 (1H, m), 5.10 (2H, s), 3.61 (3H, s), 1.56 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 136-142°C) 。

(実施例 284)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチルー1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-529)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.33-7.18 (2H, m), 7.07-6.95 (1H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.52 (3H, s), 1.50 (3H, s), 1.18 (9H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 285)

5, 5-ジメチルー4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-530)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.35-7.15 (2H, m), 7.10-6.91 (1H, m), 4.40-4.30 (2H, m), 3.75-3.67 (2H, m), 3.42 (3H, s), 1.55 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 117-122°C) 。

(実施例 286)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチルー1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-531)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.30-7.18 (2H, m), 7.05-6.95 (1H, m), 4.35-4.30 (2H, m), 3.75-3.70 (2H, m), 1.53 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.17 (9H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 287)

1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号2-532)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.35-7.20 (2H, m), 7.10-6.95 (1H, m), 5.15 (2H, s), 4.92 (1H, brd. s), 3.95-3.80 (2H, m), 1.56 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.1$ ).

物性: 油状物。

#### (実施例288)

2,2-ジメチルプロピオニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号2-533)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.30-7.20 (2H, m), 7.05-6.95 (1H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.52 (3H, s), 1.50 (3H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.18 (9H, s).

物性: 結晶(融点: 131-134°C)。

#### (実施例289)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,3,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号2-534)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.01 (1H, d,  $J=7.7$ ), 6.93 (1H, d,  $J=8.0$ ), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.09 (3H, s), 1.52 (6H, s), 1.70-1.50 (1H, m), 0.88-0.76 (4H, m).

物性: 結晶(融点: 117-118°C)。

#### (実施例290)

5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-メチル-6-エチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号2-535)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.23-7.07 (3H, m), 5.02 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.49 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.17 (3H, s), 1.53 (6H, s), 1.11 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性 : アモルファス。

(実施例 291)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-536)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.96 (1H, s), 5.11 (2H, s), 4.00-3.95 (2H, m), 3.70-3.55 (2H, m), 3.39 (3H, s), 2.27-2.10 (12H, m), 1.53 (3H, s), 1.52 (3H, s)。

物性 : アモルファス。

(実施例 292)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-537)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.82 (1H, s), 5.14 (2H, s), 4.03-3.97 (2H, m), 3.64-3.59 (2H, m), 3.40 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.11 (6H, s), 2.10 (3H, s), 1.56 (6H, s), 1.06 (9H, s)。

物性 : アモルファス。

(実施例 293)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-6-tert-ブチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-538)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.09 (2H, s), 5.01 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.29 (9H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 72-76°C)。



(実施例 2 9 4)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-6-メトキシフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-539)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.64 (2H, s), 5.02 (2H, s), 3.78 (3H, s), 3.60 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.52 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 154-157°C)。

(実施例 2 9 5)

1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-6-メトキシフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-540)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.61 (2H, s), 6.46 (1H, brd. s), 5.05 (2H, s), 3.84 (2H, q, J=7.0), 3.76 (3H, s), 2.14 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0)。

物性 : 結晶 (融点 : 149-151°C)。

(実施例 2 9 6)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチル-6-フェノキシフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-541)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.37-7.31 (2H, m), 7.14-7.09 (1H, m), 7.03-7.00 (2H, m), 6.70 (2H, s), 6.53 (1H, brd. s), 4.99 (2H, s), 3.58 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.51 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 154-158°C)。

(実施例 2 9 7)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-プロピル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-542)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.11-6.99 (3H, m), 4.01 (2H, t,  $J=6.8$ ), 2.12 (6H, s), 1.76-1.68 (2H, m), 1.45 (6H, s), 0.99 (3H, t,  $J=7.1$ ).

物性 : 結晶 (融点 : 145-146°C)。

(実施例 298)

1-イソプロピル-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-543)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-7.04 (3H, m), 4.30-4.25 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.48 (6H, s), 1.32 (6H, d,  $J=6.4$ ).

物性 : 結晶 (融点 : 176-178°C)。

(実施例 299)

1-シクロプロピルメチル-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-544)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.19-7.05 (3H, m), 6.30 (1H, s), 3.93 (2H, d,  $J=7.1$ ), 2.18 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.40-1.18 (1H, m), 0.65-0.58 (2H, m), 0.37-0.30 (2H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 137-140°C)。

(実施例 300)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(2-プロピン)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-545)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.08-6.96 (3H, m), 4.61 (2H, d,  $J=2.6$ ), 2.52 (1H, t,  $J=2.6$ ), 2.07 (6H, s), 1.43 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 158-160°C)。

(実施例 301)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メチルチオメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-546)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.18-7.06 (3H, m), 5.15 (2H, s), 2.35 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.54 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 119-120°C)。

(実施例 302)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メチルチオメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-547)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.98 (3H, m), 5.20 (2H, s), 2.37 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.06 (9H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 303)

1-エトキシエチル-5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-548)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.20-7.04 (3H, m), 4.26-4.20 (2H, m), 3.75-3.69 (2H, m), 3.57 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.17 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.23 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性 : アモルファス。

(実施例 304)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=1-エトキシエチル-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-549)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.11-6.97 (3H, s), 4.34-4.28 (2H, s), 3.78-3.72 (2H,

s), 3.59 (2H, q, J=7.3), 2.20 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.05 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 305)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メトキシエトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-550)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.26-7.08 (3H, m), 6.37 (1H, brd. s), 5.12 (2H, s), 4.02-3.96 (2H, m), 3.65-3.60 (2H, m), 3.41 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.54 (6H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 306)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 2-551)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.14-6.98 (3H, m), 5.15 (2H, s), 4.03-3.98 (2H, m), 3.65-3.59 (2H, m), 3.40 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.06 (9H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 307)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(2, 2-ジメトキシエチル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-552)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.21-7.05 (3H, m), 4.77 (1H, t, J=5.1), 4.10 (2H, d, J=5.1), 3.45 (6H, s), 2.17 (6H, s), 1.52 (6H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 308)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(2, 2-ジメトキシエチル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号2-553)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.14-6.98 (3H, m), 4.79 (1H, t,  $J=5.1$ ), 4.15 (2H, d,  $J=5.1$ ), 3.47 (6H, s), 2.19 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.05 (9H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例309)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(3-メトキシプロピル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号2-554)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-7.04 (3H, m), 6.61 (1H, brd. s), 4.17 (2H, t,  $J=6.0$ ), 3.56 (2H, t,  $J=6.0$ ), 3.34 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.98 (2H, tt,  $J=6.0, 6.0$ ), 1.50 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 97-100°C)。

(実施例310)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(2-メトキシ-1-メチルエチル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号2-555)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.06-6.94 (3H, m), 4.13-4.04 (1H, m), 3.53-3.47 (1H, m), 3.45-3.33 (1H, m), 3.31 (3H, s), 2.07 (6H, s), 1.39 (6H, s), 1.27 (3H, d,  $J=6.6$ )。

物性: アモルファス。

(実施例311)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(テトラヒドロフラン-3-イルメチル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号2-556)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.20-7.02 (3H, m), 4.08-4.00 (2H, s), 3.90-3.61 (2H, m), 3.60-3.55 (2H, m), 2.77-2.60 (1H, m), 2.15 (6H, s), 2.16-2.00 (1H, m), 1.78-1.53 (2H, m), 1.47 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 3 1 2)

5, 5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-(テトラヒドロフラン-3-イル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 2-557)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.17-7.02 (3H, m), 4.86-4.82 (1H, m), 4.09-4.05 (1H, m), 4.02-3.94 (1H, m), 3.83-3.73 (2H, m), 2.37-2.30 (1H, m), 2.15 (6H, s), 2.05-1.94 (1H, m), 1.49 (3H, s), 1.48 (3H, s)。

物性：結晶 (融点：142-147°C)。

(実施例 3 1 3)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-アザスピロ [4, 5] デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 3-8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.44 (1H, d,  $J=1.8$ ), 7.29-7.24 (1H, m), 7.07 (1H, d,  $J=8.4$ ), 5.10 (2H, d,  $J=1.1$ ), 4.57 (1H, s), 3.63 (3H, s), 2.10-1.60 (10H, m)。

物性：結晶 (融点：161-163°C)。

(実施例 3 1 4)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ [4, 5] デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 3-104)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.27-7.10 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.36-1.57 (16H, m)。

物性：結晶 (融点：170-172°C)。

(実施例 3 1 5)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2-メチル-6-クロロフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 3-136)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.22-7.18 (3H, m), 6.31 (1H, s), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.11-1.26 (10H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 172-174°C) 。

(実施例 3 1 6)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 3-248)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.92 (1H, s), 6.30 (1H, brd. s), 5.04 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.28-1.29 (22H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 170-171°C) 。

(実施例 3 1 7)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 3, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 3-232)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.08-6.96 (2H, m), 5.03 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.31-1.68 (19H, m)。

物性 : アモルファス。

(実施例 3 1 8)

3-(2, 4-ジクロロフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 3-281)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.42-7.23 (3H, m), 5.12 (2H, s), 3.63 (3H, s), 2.15-1.26 (10H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 173-174°C) 。

(実施例 3 1 9)

4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4. 5]デカン-3-エン-2-オン(化合物番号3-390)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 6.90 (2\text{H}, \text{s}), 6.06 (1\text{H}, \text{brd. s}), 5.02 (2\text{H}, \text{s}), 3.60 (3\text{H}, \text{s}), 2.27 (3\text{H}, \text{s}), 2.13 (6\text{H}, \text{s}), 2.30-1.50 (10\text{H}, \text{m})$ 。

物性: 結晶(融点: 159-161°C)。

(実施例 3 2 0)

4-(2, 2-ジメチルプロピオニルオキシ)-1-メトキシメトキシ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4. 5]デカン-3-エン-2-オン(化合物番号3-391)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 6.81 (2\text{H}, \text{s}), 5.08 (2\text{H}, \text{s}), 3.62 (3\text{H}, \text{s}), 2.23 (3\text{H}, \text{s}), 2.15 (6\text{H}, \text{s}), 2.30-1.55 (10\text{H}, \text{m}), 1.01 (9\text{H}, \text{s})$ 。

物性: 結晶(融点: 143-145°C)。

(実施例 3 2 1)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=3-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル(化合物番号3-540)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta (\text{ppm}): 7.42-7.40 (1\text{H}, \text{m}), 7.29-7.27 (2\text{H}, \text{m}), 5.06 (2\text{H}, \text{s}), 3.63 (3\text{H}, \text{s}), 2.20-0.95 (15\text{H}, \text{m})$ 。

物性: 油状物。

(実施例 3 2 2)

3-(2, 4-ジクロロフェニル)-1, 8-ジメトキシ-4-ヒドロキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン(化合物番号4-2)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta (\text{ppm}): 11.85 (1\text{H}, \text{s}), 7.64 (1\text{H}, \text{d}, J=2.2), 7.42 (1\text{H}, \text{dd}, J=8.4,$



2.2), 7.27 (1H, d, J=8.4), 3.81 (3H, s), 3.26 (3H, s), 3.48-3.30 (1H, m), 2.09-1.68 (8H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 3 2 3)

3-(2, 4-ジクロロフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 4-8)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.99 (1H, s), 7.65 (1H, d, J=2.2), 7.43 (1H, dd, J=8.4, 2.1), 7.28 (1H, d, J=8.4), 4.90 (2H, s), 3.48 (3H, s), 3.26 (3H, s), 3.49-3.33 (1H, m), 2.08-1.70 (8H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 3 2 4)

1-エトキシメトキシ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 4-11)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.96 (1H, s), 7.65 (1H, d, J=1.8), 7.53 (1H, dd, J=8.4, 1.8), 7.28 (1H, d, J=8.4), 4.94 (2H, s), 3.75 (2H, q, J=6.9), 3.41-3.24 (1H, m), 3.26 (3H, s), 2.11-1.70 (8H, m), 1.17 (3H, t, J=6.9)。

物性：アモルファス。

(実施例 3 2 5)

1, 8-ジメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 4-98)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.40 (1H, s), 7.18-7.03 (3H, m), 3.81 (3H, s), 3.48-3.30 (1H, m), 3.26 (3H, s), 2.08 (6H, s), 2.07-1.72 (8H, m)。

物性：結晶 (融点: 178.0-178.5°C)。

(実施例 3 2 6)

3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 4-104)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 11.52 (1H, s), 7.15-7.03 (3H, m), 4.90 (2H, s), 3.48 (3H, s), 3.45-3.20 (1H, m), 3.26 (3H, s), 2.18-1.70 (14H, m)。

物性：結晶 (融点：109-111°C)。

(実施例 3 2 7)

1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 4-107)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 9.06 (1H, brd. s), 7.18-7.03 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.82 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.23-3.10 (1H, m), 2.63 (3H, s), 2.17 (6H, s), 2.20-1.62 (8H, m), 1.27 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：結晶 (融点：132-137°C)。

(実施例 3 2 8)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=3-(2, 4-ジクロロフェニル)-8-メトキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 4-399)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40 (1H, d,  $J=1.1$ ), 7.28 (2H, d,  $J=1.1$ ), 5.06 (2H, s), 3.63 (3H, s), 3.40 (3H, s), 3.38-3.28 (1H, m), 2.77-1.66 (9H, m)。

物性：油状物。

(実施例 3 2 9)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=3-(2, 4-ジクロロフェニル)-1, 8-ジメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 4-400)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40 (1H, d,  $J=1.8$ ), 7.28 (2H, d,  $J=1.8$ ), 4.00 (3H, s), 3.49-3.40 (1H, m), 3.40 (3H, s), 2.25-1.68 (9H, m), 1.05-0.94 (4H, m)。

物性 : 油状物。

(実施例 3 3 0)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメチル-3-(2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 4-401)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.48-7.43 (2H, m), 7.07-6.89 (5H, m), 5.16 (2H, s), 3.92 (2H, q,  $J=6.9$ ), 3.82 (3H, s), 3.33 (3H, s), 3.30-3.23 (1H, m), 2.25-1.81 (14H, m), 1.30 (3H, t,  $J=6.9$ )。

物性 : 油状物。

(実施例 3 3 1)

2-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメチル-3-(2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 4-402)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.81 (1H, dd,  $J=8.1, 1.4$ ), 7.40 (1H, dd,  $J=7.7, 1.4$ ), 7.23-7.15 (2H, m), 7.09-6.93 (3H, m), 5.17 (2H, s), 3.90 (2H, q,  $J=6.9$ ), 3.34 (3H, s), 3.41-3.28 (1H, m), 2.31-1.72 (14H, m), 1.30 (3H, t,  $J=6.9$ )。

物性 : 油状物。

(実施例 3 3 2)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-1,8-ジメトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 4-403)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.99 (3H, m), 4.01 (3H, s), 3.47-3.36 (1H, m), 3.39 (3H, s), 2.19 (6H, s), 2.18-1.50 (9H, m), 0.88-0.72 (4H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 130-133°C)。

(実施例 3 3 3)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-1,8-ジメトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル(化合物番号4-404)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-6.99 (3H, m), 4.01 (3H, s), 3.47-3.35 (1H, m), 3.38 (3H, s), 2.19 (6H, s), 2.15-1.68 (8H, m), 1.22 (3H, s), 1.03-0.98 (2H, m), 0.67-0.61 (2H, m)。

物性: 結晶(融点: 125-130°C)。

(実施例 3 3 4)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル(化合物番号4-405)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-7.00 (3H, m), 5.08 (2H, s), 3.62 (3H, s), 3.40 (3H, s), 3.39-3.25 (1H, m), 2.25-1.50 (15H, m), 0.88-0.72 (4H, m)。

物性: 結晶(融点: 89-90°C)。

(実施例 3 3 5)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル(化合物番号4-406)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-7.00 (3H, m), 5.07 (2H, s), 3.63, 3.62 (3H, s, s), 3.55-3.45 (0.4H, m), 3.39, 3.36 (3H, s, s), 3.37-3.25 (0.6H, m), 2.55-1.60 (14H, m), 1.22, 1.21 (3H, s, s), 1.01-0.90 (2H, m), 0.67-0.60 (2H, m)。

物性: 結晶(融点: 79-84°C)。

(実施例 3 3 6)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメチル-3-(2,6

ージメチルフェニル)ー8ーメトキシー1ーアザスピロ[4, 5]デカンー3ーエンー2ーオンー4ーイル=エステル(化合物番号4-407)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.15-6.99 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.40 (3H, s), 3.39-3.23 (1H, m), 2.27-1.55 (15H, m), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.88-0.74 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例337)

1ーメチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=1ーエトキシメチルー3ー(2, 6ージメチルフェニル)ー8ーメトキシー1ーアザスピロ[4, 5]デカンー3ーエンー2ーオンー4ーイル=エステル(化合物番号4-408)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.16-6.99 (3H, s), 5.13 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.39 (3H, s), 3.36-3.23 (1H, m), 2.26-1.55 (14H, m), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.23 (3H, s), 1.02-0.96 (2H, m), 0.67-0.61 (2H, m)。

物性：結晶(融点：105-107°C)。

(実施例338)

アセティックアシッド=1ーエトキシメチルー3ー(2, 6ージメチルフェニル)ー8ーメトキシー1ーアザスピロ[4, 5]デカンー3ーエンー2ーオンー4ーイル=エステル(化合物番号4-410)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.39 (3H, s), 3.40-3.23 (1H, m), 2.30-1.60 (8H, m), 2.20 (6H, s), 2.01 (3H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性：結晶(融点：74-75°C)。

(実施例339)

プロピオニックアシッド=1ーエトキシメチルー3ー(2, 6ージメチルフェニル)ー8ーメトキシー1ーアザスピロ[4, 5]デカンー3ーエンー2ーオンー4ーイル=エステル(化合物番号4-411)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.94 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.38 (3H, s), 3.35-3.25 (1H, m), 2.26-1.68 (8H, m), 2.20 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.01 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性 : 油状物。

(実施例 3 4 0)

3 - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1 - メトキシエチル - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 2 - オン (化合物番号 4 - 4 1 4)

一方の立体異性体 :

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm) : 11.42 (1H, brd. s), 7.17-7.02 (3H, m), 4.15-4.10 (2H, m), 3.58-3.53 (2H, m), 3.40-3.30 (1H, m), 3.28 (3H, s), 3.25 (3H, s), 2.16-1.75 (8H, m), 2.07 (6H, s)。

物性 : 油状物。

もう一方の立体異性体 :

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm) : 7.14-7.00 (3H, m), 4.15-4.10 (2H, m), 3.58-3.54 (2H, m), 3.35-3.25 (1H, m), 3.27 (3H, s), 3.26 (3H, s), 2.15-1.75 (8H, m), 2.07 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 161-165°C)。

(実施例 3 4 1)

アセティックアシッド = 3 - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 1 - メトキシエチル - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 2 - オン - 4 - イル = エステル (化合物番号 4 - 4 1 5)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.67 (2H, m), 3.43, 3.42 (0.75H, 2.25H, s, s), 3.45-3.35 (1H, m), 3.38 (3H, s), 2.35-1.65 (8H, m), 2.19 (6H, s), 2.00, 1.99 (2.25H, 0.75H, s, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 3 4 2)

プロピオニックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メトキシエチル-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル(化合物番号4-416)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.16-6.99 (3H, m), 4.36-4.31 (2H, m), 3.96, 3.95 (0.5H, 1.5H, q, q,  $J=7.0, 7.0$ ), 3.75-3.67 (2H, m), 3.45-3.35 (1H, m), 3.43, 3.42 (0.75H, 2.25H, s, s), 3.37 (3H, s), 2.35-1.75 (8H, m), 2.20 (6H, s), 1.03, 1.02 (2.25H, 0.75H, t, t,  $J=7.0, 7.0$ ).

物性 : 油状物。

(実施例 3 4 3)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-1-メトキシエチル-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル(化合物番号4-418)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.99 (3H, m), 4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.67 (2H, m), 3.45-3.35 (1H, m), 3.43, 3.42 (0.75H, 2.25H, s, s), 3.39 (3H, s), 2.35-1.70 (8H, m), 1.70-1.50 (1H, m), 0.88-0.70 (4H, m).

物性 : 油状物。

(実施例 3 4 4)

5,5-ジメチル-4-ヒドロキシ-1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号5-1)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.92 (2H, s), 6.20 (1H, brd. s), 2.44 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.13 (6H, s), 1.49 (6H, s).

物性 : 結晶(融点 : 203-204°C)。

(実施例 3 4 5)

炭酸=メチル=エステル=5,5-ジメチル-1-メチルチオ-2-オキソ-3

— (2, 4, 6-トリメチルフェニル) — 2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号5-16)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 3.60 (3H, s), 2.48 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.05 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例346)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号5-39)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 2.98 (2H, q, J=7.3), 2.48 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.53 (6H, s), 1.16 (3H, t, J=7.3)。

物性: 油状物。

(実施例347)

4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メチルチオ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4.5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号5-67)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.92 (2H, s), 6.03 (1H, brd. s), 3.55-3.45 (1H, m), 3.39 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.13 (6H, s), 2.56-2.00 (4H, m), 1.82-1.62 (2H, m), 1.58-1.12 (2H, m)。

物性: 結晶 (融点: 193-196 °C)。

(実施例348)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[8-メトキシ-1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4.5]デカン-3-エン-4-イル] エステル (化合物番号5-68)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 3.49-3.26 (4H, m), 2.56-1.50 (17H, m), 1.02 (4H, s), 0.99 (5H, s)。



物性：アモルファス。

(実施例 3 4 9)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド = [8-メトキシ-1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-アザスピロ[4.5]デカン-3-エン-4-イル] エステル (化合物番号 5-70)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 3.53-3.29 (1H, m), 3.02-2.90 (2H, m), 2.46, 2.45 (3H, s, s), 2.22 (3H, s), 2.15 (6H, s), 2.60-1.50 (8H, m), 1.16-1.07 (3H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 3 5 0)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド = 5, 5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル = エステル (化合物番号 5-93)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 2.88 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.23 (3H, s), 2.18 (2H, s), 2.13 (6H, s), 1.45 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.3$ ), 0.83 (9H, s)。

物性：結晶 (融点: 77-81°C)。

(実施例 3 5 1)

炭酸 = 1, 2-イソブチル = エステル = 5, 5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル = エステル (化合物番号 5-99)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.84 (2H, s), 3.74 (2H, d,  $J=6.6$ ), 2.88 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.76 (1H, septet,  $J=6.6$ ), 1.50 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.3$ ), 0.77 (6H, d,  $J=6.6$ )。

物性：油状物。

(実施例 3 5 2)

炭酸=シクロペンチル=エステル=5,5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号5-101)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.84-4.80 (1H, m), 2.88 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.69-1.35 (8H, m), 1.28 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例353)

炭酸=3,3-ジメチルブチル=エステル=5,5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号5-104)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 3.67 (2H, s), 2.89 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.24 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.3$ ), 0.77 (9H, s).

物性: 油状物。

(実施例354)

炭酸=テトラヒドロフラン-2-イルメチル=エステル=5,5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号5-105)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.02-3.88 (3H, m), 3.80-3.70 (2H, m), 2.88 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.89-1.60 (4H, m), 1.49 (6H, s), 1.27 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例355)

炭酸=2-イソプロポキシエチル=エステル=5,5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号5-108)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.85 (2H, s), 4.11-4.06 (2H, m), 3.54-3.39 (3H, m), 2.88

(2H, q, J=7.3), 2.25 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.28 (3H, t, J=7.3), 1.11 (6H, d, J=6.2)。

物性：油状物。

(実施例 3 5 6)

炭酸=1, 2-ジメチルプロピル=エステル=5, 5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-109)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 4.23 (1H, m), 2.89 (2H, q, J=7.3), 2.23 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.65-1.55 (1H, m), 1.50 (6H, s), 1.28 (3H, t, J=7.3), 0.97 (3H, d, J=6.6), 0.74 (6H, dd, J=7.0, 1.8)。

物性：油状物。

(実施例 3 5 7)

炭酸=1, 1-ジメチルプロパン-2-イニル=エステル=5, 5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-110)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.83 (2H, s), 2.88 (2H, q, J=7.3), 2.43 (1H, s), 2.23 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.42 (6H, s), 1.27 (3H, t, J=7.3)。

物性：油状物。

(実施例 3 5 8)

炭酸=1, 2, 2-トリメチルプロピル=エステル=5, 5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-111)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 4.28 (1H, q, J=6.6), 2.89 (2H, q, J=7.3), 2.22 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.28 (3H, t, J=7.3), 0.94 (3H, d, J=6.6), 0.751 (9H, s)。

物性：油状物。

(実施例 3 5 9)

炭酸=1-イソプロピル-2-メチルプロピル=エステル=5,5-ジメチル-1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-112)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.80 (2H, s), 4.14 (1H, t,  $J=6.2$ ), 2.89 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.21 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.89-1.72 (2H, m), 1.58 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.3$ ), 0.67 (12H, m)。

物性: 結晶 (融点: 89-90°C)。

(実施例 3 6 0)

3,3-ジメチルブテノイックアシッド=5,5-ジメチル-1-プロピルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-164)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 2.82 (2H, t,  $J=7.7$ ), 2.23 (3H, s), 2.18 (2H, s), 2.13 (6H, s), 1.72-1.58 (2H, m), 1.45 (6H, s), 1.04 (3H, t,  $J=7.7$ ), 0.83 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 57-58°C)。

(実施例 3 6 1)

3,3-ジメチルブチリックアシッド=5,5-ジメチル-1-イソプロピルチオ-2-オキソ-3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 5-168)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.82 (2H, s), 3.41 (1H, septet,  $J=6.6$ ), 2.23 (3H, s), 2.18 (2H, s), 2.14 (6H, s), 1.45 (6H, s), 1.26 (6H, d,  $J=6.6$ ), 0.83 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 89-91°C)。

(実施例 3 6 2)

3,3-ジメチルブチリックアシッド=5,5-ジメチル-1-ブチルチオ-2

ーオキソー3ー(2, 4, 6-トリメチルフェニル)ー2, 5-ジヒドロ-1H-  
ピロール-4-イル=エステル(化合物番号5-172)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 2.85 (2H, t,  $J=9.5$ ), 2.23 (3H, s), 2.18  
(2H, s), 2.13 (6H, s), 1.66-1.45 (4H, m), 1.45 (6H, s), 0.91 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例363)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-イソブチルチオ-  
ー2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)ー2, 5-ジヒドロ-1H-  
ピロール-4-イル=エステル(化合物番号5-176)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 6.81 (2H, s), 2.73 (2H, d,  $J=7.0$ ), 2.23 (3H, s), 2.18  
(2H, s), 2.13 (6H, s), 1.98-1.82 (1H, m), 1.45 (6H, s), 1.05 (6H, d,  $J=6.6$ ),  
0.83 (9H, s)。

物性: 結晶(融点: 51-52°C)。

(実施例364)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ベンジルチオ-  
ー2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)ー2, 5-ジヒドロ-1H-  
ピロール-4-イル=エステル(化合物番号5-184)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.33-7.26 (5H, m), 6.82 (2H, s), 4.13 (2H, s), 2.24 (3H,  
s), 2.14 (6H, s), 1.18 (6H, s), 0.81 (9H, s)。

物性: 油状物。

(実施例365)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-フェニルチオ-  
ー2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)ー2, 5-ジヒドロ-1H-  
ピロール-4-イル=エステル(化合物番号5-188)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.41-7.20 (5H, m), 6.82 (2H, s), 2.25 (3H, s), 2.19 (6H,  
s), 2.18 (2H, s), 1.39 (6H, s), 0.83 (9H, s)。

物性：結晶（融点：109-111℃）。

(実施例 3 6 6)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド＝5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2, 4, 6－トリメチルフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル＝エステル（化合物番号5－190）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.84 (2H, s), 2.45 (3H, s), 2.13 (6H, s), 1.67-1.52 (1H, m), 1.47 (6H, s), 0.92-0.77 (4H, m)。

物性：結晶（融点：89-92℃）。

(実施例 3 6 7)

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2－クロロフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル] エステル（化合物番号6－4）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.38-7.19 (4H, m), 3.02 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.50 (3H, s), 1.54 (6H, s), 1.22 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：結晶（融点：89-90℃）。

(実施例 3 6 8)

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2－トリフルオロメチルフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル] エステル（化合物番号6－8）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.67-7.35 (4H, m), 2.99 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.49 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.50 (3H, s), 1.21 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：油状物。

(実施例 3 6 9)

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2－クロロ－4－メチルフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1

H-ピロールー 4-イル] エステル (化合物番号 6-12)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.22-7.17 (2H, m), 7.10-7.05 (1H, m), 3.04 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.49 (3H, s), 2.31 (3H, s), 1.53 (6H, s), 1.24 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例 370)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチルー 1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロールー 4-イル] エステル (化合物番号 6-16)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.21-7.17 (2H, m), 7.09-7.05 (1H, m), 3.04 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.91 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.91 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.30 (3H, s), 1.52 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.3$ ), 1.24 (3H, t,  $J=7.5$ ).

物性: 油状物。

(実施例 371)

ジチオ炭酸=S-エチル=エステル=O-[5, 5-ジメチルー 1-プロピルチオ-2-オキソ-3-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロールー 4-イル] エステル (化合物番号 6-20)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.21-7.17 (2H, m), 7.09-7.04 (1H, m), 3.04 (2H, q,  $J=7.5$ ), 2.84 (2H, t,  $J=7.3$ ), 2.30 (3H, s), 1.77-1.58 (2H, m), 1.51 (6H, s), 1.24 (3H, t,  $J=7.5$ ), 1.04 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例 372)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチルー 1-エチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロールー 4-イル=エステル (化合物番号 6-30)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.38 (1H, m), 7.29-7.26 (2H, m), 2.89 (2H, q,  $J=7.4$ ), 1.45 (6H, s), 1.27 (3H, t,  $J=7.4$ ), 1.20 (9H, s).

物性：結晶（融点：73-76℃）。

(実施例 3 7 3)

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2－ブromo－4－メチルフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル] エステル（化合物番号6－36）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.38-7.37 (1H, m), 7.18-7.09 (2H, m), 3.03 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.49 (3H, s), 2.30 (3H, s), 1.52 (6H, brd.s), 1.23 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：油状物。

(実施例 3 7 4)

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2－メチル－4－メトキシフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル] エステル（化合物番号6－40）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.07-7.03 (1H, m), 6.72-6.67 (2H, m), 3.77 (3H, s), 3.01 (2H, q,  $J=7.7$ ), 2.48 (3H, s), 2.22 (3H, s), 1.51 (6H, s), 1.21 (3H, t,  $J=7.7$ )。

物性：油状物。

(実施例 3 7 5)

ジチオ炭酸＝S－エチル＝エステル＝O－[1－エチルチオ－5, 5－ジメチル－2－オキソ－3－(2－クロロフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル] エステル（化合物番号6－41）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.38-7.22 (4H, m), 3.02 (2H, q,  $J=7.3$ ), 2.92 (2H, q,  $J=7.3$ ), 1.56 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.3$ ), 1.22 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：結晶（融点：97-98℃）。

(実施例 3 7 6)

2－クロロベンゾイックアシッド＝5, 5－ジメチル－1－メチルチオ－2－オキソ－3－(2－クロロフェニル)－2, 5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イ



ル＝エステル（化合物番号6-42）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.86-7.81 (1H, m), 7.52-7.25 (7H, m), 2.52 (3H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例377)

チオホスホニックアシッド＝O, O'-ジエチルエステル＝O'-[5, 5-ジメチルー1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル（化合物番号6-43）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.07-8.02 (1H, m), 7.44-7.28 (3H, m), 4.26-4.04 (4H, m), 2.08 (3H, s), 1.79 (3H, s), 1.60 (3H, s), 1.28-1.18 (6H, m)。

物性：油状物。

(実施例378)

ジチオ炭酸＝S-エチル＝エステル＝O-[1-tert-ブチルチオ-5, 5-ジメチルー2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル（化合物番号6-44）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.39-7.21 (4H, m), 3.01 (2H, q,  $J=7.3$ ), 1.60 (6H, s), 1.46 (9H, s), 1.21 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性：結晶（融点：99-103°C）。

(実施例379)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド＝5, 5-ジメチルー1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル＝エステル（化合物番号6-45）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.25 (3H, m), 2.48 (3H, s), 1.80-1.68 (1H, m), 1.48 (6H, s), 1.05-0.97 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例 380)

シクロプロパンカルボキシリクアシッド=5,5-ジメチル-1-メチルチオ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 6-46)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-6.98 (3H, m), 2.48 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.67-1.55 (1H, m), 1.48 (6H, s), 0.90-0.75 (4H, m)。

物性: 油状物。

(実施例 381)

2-[N-ヒドロキシ-N-[(2,4-ジクロロフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチル=エステル (化合物番号 8-60)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)$   $\delta$  (ppm): 10.06 (1H, s), 7.54 (1H, m), 7.37-7.34 (2H, m), 3.99 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.83 (2H, s), 1.35 (6H, s), 1.12 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 115-116°C)。

(実施例 382)

2-[N-メトキシ-N-[(2,4-ジクロロフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチル=エステル (化合物番号 8-61)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.38 (1H, m), 7.22-7.21 (2H, m), 4.14 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.97-3.30 (2H, m), 3.91 (3H, s), 1.65-1.45 (6H, m), 1.22 (3H, t,  $J=7.0$ )。

(実施例 383)

2-[N-ヒドロキシ-N-[(2-クロロ-4-メチルフェニル)アセチル]アミノ-2-メチルプロピオニックアシッド=エチル=エステル (化合物番号 8-65)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.19-7.13 (2H, m), 7.03-6.99 (1H, m), 6.52 (1H, brd. s), 4.17 (2H, q,  $J=7.3$ ), 3.88 (2H, s), 2.32 (3H, s), 1.54 (6H, s), 1.24 (3H, t,  $J=7.3$ )。

(実施例 3 8 4)

N- (1-シアノ-4-メチルシクロヘキシル) -N-ヒドロキシー-2- (2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセタミド (化合物番号 9-3)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 10.31 (1H, s), 6.81 (2H, s), 3.74 (2H, s), 2.20 (3H, s), 2.12 (6H, s), 2.50-2.20 (2H, m), 1.90-1.70 (4H, m), 1.52-1.10 (3H, m), 0.90 (3H, d,  $J=3.3$ )。

(実施例 3 8 5)

N- (1-シアノ-4-メトキシシクロヘキシル) -N-ヒドロキシー-2- (2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセタミド (化合物番号 9-4)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 10.36 (1H, s), 6.79 (2H, s), 3.73 (2H, s), 3.28 (1H, m), 3.22 (3H, s), 2.59-1.83 (8H, m), 2.18 (3H, s), 2.101 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 3 8 6)

N- (1-シアノ-4-メチルシクロヘキシル) -N-メトキシ-2- (2, 4, 6-トリメチルフェニル) アセタミド (化合物番号 9-11)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 6.86 (2H, s), 4.09-3.60 (2H, m), 3.40 (3H, s), 2.51-2.30 (2H, m), 2.25 (3H, s), 2.22 (6H, s), 2.20-1.70 (4H, m), 1.50-1.33 (3H, m), 0.94 (3H, d,  $J=3.3$ )。

(実施例 3 8 7)

1, 4-ビス (メトキシメトキシ) -5, 5-ジメチル-3- (2, 6-ジメチルフェニル) -2-オキソ-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 10-1)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.0-7.2 (3H, m), 5.03 (2H, s), 4.69 (2H, s), 3.60 (3H, s), 3.36 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 388)

1, 4-ビス(メトキシメトキシ)-5, 5-ジメチル-3-(2-メチル-6-クロロフェニル)-2-オキソ-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号10-46)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.13-7.23 (3H, m), 5.03 (2H, s), 4.79 (2H, ABq,  $J=5.5$ ), 3.60 (3H, s), 3.38 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.52 (3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 389)

5, 5-ジメチル-1, 4-ビス(メトキシメチル)-2-オキソ-3-(2-クロロ-6-フルオロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号10-136)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.35-7.18 (2H, m), 7.05-6.95 (1H, m), 5.02 (2H, s), 4.89 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.38 (3H, s), 1.53 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 390)

5, 5-ジメチル-1, 4-ビス(メトキシメチル)-2-オキソ-3-(2-プロモ-4, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール(化合物番号10-137)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.26 (1H, s), 6.98 (1H, s), 5.02 (2H, s), 4.82 (2H, ABq,  $J=5.5$ ), 3.59 (3H, s), 3.39 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.51 (3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 391)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号10-138)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.00 (1H, d,  $J=7.7$ ), 6.91 (1H, d,  $J=7.7$ ), 4.33-4.27 (2H, m), 3.73-3.67 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.08 (3H, s), 1.65-1.52 (1H, m), 1.52 (6H, s), 0.90-0.75 (4H, m)。

物性 : 油状物。

(実施例 392)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロ-6-メチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-139)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.24 (1H, s), 7.13 (1H, brd. s), 5.04 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.26 (3H, s), 1.68-1.48 (7H, m), 1.07-0.84 (4H, m)。

物性 : 油状物。

(実施例 393)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(3-クロロ-2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-140)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.94 (1H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.13 (3H, s), 1.68-1.58 (1H, m), 1.52 (3H, s), 1.50 (3H, s), 0.98-0.76 (4H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 78-79°C)。

(実施例 394)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 3, 4, 6-テトラメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-141)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.84 (1H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.11 (3H, s), 2.10 (3H, s), 1.67-1.52 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.11-0.78 (4H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 3 9 5)

シクロプロパンカルボキシリクアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチル-4-tert-ブチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号10-142)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.01 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.70-1.15 (1H, m), 1.50 (6H, s), 1.27 (9H, s), 0.89-0.68 (2H, m), 0.68-0.59 (2H, m)。

物性：結晶(融点:124-126°C)。

(実施例 3 9 6)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号10-143)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.69-7.65 (1H, m), 7.54-7.47 (1H, m), 7.00-6.92 (2H, m), 6.55 (2H, s), 5.08 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.63 (3H, s), 2.24 (6H, s), 1.56 (6H, s)。

物性：結晶(融点:104-105°C)。

(実施例 3 9 7)

シクロプロパンカルボキシリクアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル(化合物番号10-144)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 6.58 (2H, s), 5.05 (2H, s), 3.77 (3H, s), 3.61 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.67-1.55 (1H, m), 1.50 (6H, s), 0.92-0.80 (4H, m)。

物性：結晶(融点:121-123°C)。

(実施例 398)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-145)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.69-7.10 (2H, m), 7.00-6.93 (2H, m), 6.55 (2H, s), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, q, J=6.9), 3.73 (3H, s), 2.24 (6H, s), 1.56 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=6.9)。

物性: 結晶 (融点: 72-77°C)。

(実施例 399)

アセティックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-146)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.12-7.01 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.20 (6H, s), 2.04 (3H, s), 1.50 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 87-89°C)。

(実施例 400)

イソブチリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-147)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.14-6.98 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.61-2.50 (1H, m), 2.20 (6H, s), 1.50 (6H, s), 0.99 (6H, d, J=6.9)。

物性: 結晶 (融点: 99-100°C)。

(実施例 401)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-148)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.70-7.00 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.67-1.54 (1H, m), 1.51 (6H, s), 0.87-0.83 (2H, m), 0.79-0.76 (2H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 136-138°C) 。

(実施例 402)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-149)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.97 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.23 (3H, s), 1.06-1.01 (2H, m), 0.70-0.64 (2H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 104-107°C) 。

(実施例 403)

2-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-150)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.37-1.31 (1H, m), 1.10-0.93 (5H, m), 0.70-0.66 (1H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 66-68°C) 。

(実施例 404)

2, 2-ジクロロ-1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-151)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.13-6.95 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.20 (3H, s), 2.11 (1H, d,  $J=7.7$ ), 1.55 (3H, s), 1.52 (3H, s), 1.41 (3H, s), 1.38 (1H, d,  $J=7.7$ )。

物性 : 油状物。



(実施例 405)

2, 2-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-152)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.10-6.95 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (2H, s), 2.20 (6H, s), 1.60-1.38 (2H, m), 1.49 (6H, s), 1.03 (6H, s), 0.53 (3H, t,  $J=7.2$ ).

物性: 結晶 (融点: 60-61°C)。

(実施例 406)

3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-153)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.11-6.90 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 3.51 (2H, s), 2.20 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.08 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 84-88°C)。

(実施例 407)

3-クロロプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-154)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.12-7.00 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.58 (2H, t,  $J=6.4$ ), 2.77 (2H, t,  $J=6.4$ ), 2.19 (6H, s), 1.52 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 84-87°C)。

(実施例 408)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-155)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.95 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.25-3.05 (1H, m), 2.35-1.68 (6H, m), 2.20 (6H, s), 1.50 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 106-110°C) 。

(実施例 4 0 9)

シクロペンタンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1 0-1 5 6)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.95 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.82-2.67 (1H, m), 2.20 (6H, s), 1.95-1.38 (8H, m), 1.50 (6H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 4 1 0)

シクロヘキサンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1 0-1 5 7)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.13-6.95 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.40-2.25 (1H, m), 2.19 (6H, s), 2.00-1.10 (10H, m), 1.49 (6H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 4 1 1)

2-クロロアクリリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 1 0-1 5 8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.98 (3H, m), 6.51 (1H, d,  $J=2.0$ ), 6.07 (1H, d,  $J=2.0$ ), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.54 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 81-83°C) 。

(実施例 4 1 2)

2-クロロベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-159)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.58-7.23 (4H, m), 7.15-6.97 (3H, m), 5.09 (2H, s), 3.64 (3H, s), 2.25 (6H, s), 1.60 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 94-99°C)。

#### (実施例413)

2-メチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-160)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.84-7.80 (1H, m), 7.45-7.37 (1H, m), 7.28-7.18 (2H, m), 7.10-6.93 (3H, m), 5.09 (2H, s), 3.63 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.25 (6H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 76-78°C)。

#### (実施例414)

炭酸=メチル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-161)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.14-7.02 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 3.58 (3H, s), 2.20 (2H, s), 1.54 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 158-160°C)。

#### (実施例415)

炭酸=エチル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-162)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.13-7.01 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.98 (2H, q, J=7.0),

3.61 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.54 (6H, s), 1.06 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶（融点：69-73℃）。

(実施例 4 1 6)

チオカルボニックアシッド=S-メチルエステル=O-[5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 10-163)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.61 (3H, s), 2.19 (6H, s), 2.17 (3H, s), 1.52 (6H, s)。

物性：結晶（融点：98-102℃）。

(実施例 4 1 7)

ジメチルカルバミックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 10-164)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.15-7.00 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.91 (3H, s), 2.72 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性：結晶（融点：110-111℃）。

(実施例 4 1 8)

ジメチルチオカルバミックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 10-165)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.15-6.98 (3H, m), 5.06 (2H, s), 3.62 (3H, s), 3.18 (6H, s), 2.26 (6H, s), 1.57 (6H, s)。

物性：結晶（融点：151-155℃）。

(実施例 4 1 9)

4-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ

－ 3 － ( 2, 6－ジメチルフェニル)－ 2, 5－ジヒドロ－ 1 H－ピロール (化合物番号 1 0－ 1 6 6)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.13-7.01 (3H, m), 5.02 (2H, s), 4.73 (2H, s), 3.59 (3H, s), 3.58 (2H, q,  $J=7.2$ ), 2.19 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.15 (3H, t,  $J=7.2$ ).

物性 : 油状物。

(実施例 4 2 0)

シクロプロパンカルボキシリクアシッド＝ 1－エトキシメトキシ－ 5, 5－ジメチル－ 2－オキソ－ 3－ ( 2, 6－ジメチルフェニル)－ 2, 5－ジヒドロ－ 1 H－ピロール－ 4－イル＝エステル (化合物番号 1 0－ 1 6 7)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-6.98 (3H, m), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=2.0$ ), 2.19 (6H, s), 1.70-1.50 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.95-0.70 (4H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 103-104°C)。

(実施例 4 2 1)

1－メチルシクロプロパンカルボキシリクアシッド＝ 1－エトキシメトキシ－ 5, 5－ジメチル－ 2－オキソ－ 3－ ( 2, 6－ジメチルフェニル)－ 2, 5－ジヒドロ－ 1 H－ピロール－ 4－イル＝エステル (化合物番号 1 0－ 1 6 8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.95 (3H, m), 5.10 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.19 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.22 (3H, s), 1.06-1.01 (2H, m), 0.69-0.64 (2H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 88-91°C)。

(実施例 4 2 2)

1－フェニルシクロプロパンカルボキシリクアシッド＝ 1－エトキシメトキシ－ 5, 5－ジメチル－ 2－オキソ－ 3－ ( 2, 6－ジメチルフェニル)－ 2, 5－ジヒドロ－ 1 H－ピロール－ 4－イル＝エステル (化合物番号 1 0－ 1 6 9)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.30-7.26 (3H, m), 7.20-7.13 (3H, m), 7.06-7.02 (2H,

m), 5.07 (2H, s), 3.84 (2H, q, J=7.1), 2.08 (6H, s), 1.40-1.30 (2H, m), 1.36 (6H, s), 1.27 (3H, t, J=7.1), 1.19-1.13 (2H, m)。

物性：油状物。

(実施例 4 2 3)

1-(4-エトキシフェニル)-2,2-ジクロロシクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-170)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.24-7.16 (2H, m), 7.06-6.76 (5H, m), 5.08 (2H, s), 4.06 (3H, t, J=7.0), 3.84 (3H, t, J=7.3), 2.44 (1H, d, J=7.7), 2.20 (3H, s), 1.89 (1H, d, J=7.7), 1.78 (3H, s), 1.45 (3H, t, J=7.0), 1.42 (3H, s), 1.38 (3H, s), 1.27 (3H, t, J=7.3)。

物性：油状物。

(実施例 4 2 4)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-171)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-6.95 (3H, m), 5.11 (2H, s), 3.87 (2H, q, J=7.0), 3.23-3.05 (1H, m), 2.30-1.60 (6H, m), 2.20 (6H, s), 1.49 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶 (融点: 99-102°C)。

(実施例 4 2 5)

2-クロロアクリリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-172)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-6.97 (3H, m), 6.51 (1H, d, J=1.8), 6.07 (1H, d,

J=1.8), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q, J=7.0), 2.21 (6H, s), 1.54 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶（融点：89-91℃）。

(実施例 4 2 6)

3-メチルオキセタン-3-カルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-173）

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.16-6.99 (3H, m), 5.12 (2H, s), 4.64 (2H, d, J=6.2), 4.30 (2H, d, J=6.2), 3.88 (2H, q, J=7.3), 2.20 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.43 (3H, s), 1.30 (3H, t, J=7.3)。

物性：結晶（融点：109-113℃）。

(実施例 4 2 7)

2-クロロベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-174）

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.57-7.23 (4H, m), 7.16-6.96 (3H, m), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q, J=7.0), 2.25 (6H, s), 1.60 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 4 2 8)

2-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-175）

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.84-7.79 (1H, m), 7.45-7.37 (1H, m), 7.30-7.18 (2H, m), 7.10-6.93 (3H, m), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q, J=7.0), 2.31 (3H, s), 2.24 (6H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 4 2 9)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-176)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.67-7.60 (1H, m), 7.53-7.43 (1H, m), 7.10-6.90 (5H, m), 5.14 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.82 (3H, s), 2.26 (6H, s), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 111-114°C)。

(実施例 4 3 0)

チオホスホンニックアシッド=O, O'-ジエチルエステル=O'-[1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号 10-177)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.16-6.99 (3H, m), 5.30 (2H, s), 3.92-3.73 (4H, m), 3.65-3.48 (2H, m), 2.25 (6H, s), 1.55 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.14 (6H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 4 3 1)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-178)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.13-6.95 (3H, m), 4.32-4.27 (2H, m), 3.73-3.67 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.67-1.53 (1H, m), 1.52 (6H, s), 0.88-0.75 (4H, m).

物性: 油状物。



(実施例 4 3 2)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-179)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.15-6.95 (3H, m), 4.33-4.26 (2H, m), 3.73-3.67 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.22 (3H, s), 1.06-1.01 (2H, m), 0.69-0.64 (2H, m)。

物性 : 油状物。

(実施例 4 3 3)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-180)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.15-6.97 (3H, m), 4.33-4.27 (2H, m), 3.75-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 3.23-3.05 (1H, m), 2.40-1.65 (6H, m), 2.19 (6H, s), 1.50 (6H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 4 3 4)

2, 2-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-181)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.15-6.93 (3H, m), 4.35-4.27 (2H, m), 3.75-3.67 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.50 (6H, s), 1.45 (2H, q,  $J=7.3$ ), 1.02 (6H, s), 0.53 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性 : 油状物。

(実施例 4 3 5)

3-クロロ-2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1

ーメトキシエトキシー2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-182)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-6.95 (3H, m), 4.35-4.28 (2H, m), 3.75-3.68 (2H, m), 3.50 (2H, s), 3.43 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.53 (6H, s), 1.08 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例436)

2-アセトキシ-2-メチルプロピオン酸=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-183)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-6.95 (3H, m), 4.35-4.28 (2H, m), 3.75-3.68 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.24 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 59-61°C)。

(実施例437)

2-メチルベンゾイック酸=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-184)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.83-7.88 (1H, m), 7.46-7.38 (1H, m), 7.30-7.18 (2H, m), 7.10-6.95 (3H, m), 4.37-4.30 (2H, m), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.24 (6H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例438)

2-クロロベンゾイック酸=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-185)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.58-7.23 (4H, m), 7.15-6.98 (3H, m), 4.38-4.32 (2H, m), 3.77-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.25 (6H, s), 1.60 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 3 9)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-186)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.66-7.60 (1H, m), 7.53-7.43 (1H, m), 7.10-6.88 (5H, m), 4.35-4.30 (2H, m), 3.82 (3H, s), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.26 (6H, s), 1.58 (6H, s)。

物性：結晶 (融点 : 65-67°C)。

(実施例 4 4 0)

炭酸=エチル=エステル=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-187)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.16-6.98 (3H, m), 4.33-4.27 (2H, m), 3.75-3.68 (2H, m), 3.59 (3H, s), 3.43 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.55 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 4 1)

4-シアノメトキシ-5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 10-188)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.25-7.05 (3H, m), 4.38 (2H, s), 4.30-4.23 (2H, m), 3.73-3.66 (2H, m), 3.42 (3H, s), 2.23 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性：結晶 (融点 : 101-103°C)。

(実施例 4 4 2)

5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-4-メトキシメトキシ-2-オキソ

— 3 — (2, 6-ジメチルフェニル) — 2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 10-189)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.15-6.98 (3H, m), 4.67 (2H, s), 4.27-4.22 (2H, m), 3.74-3.67 (2H, m), 3.42 (3H, s), 3.36 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.53 (6H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 443)

5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-4-メチルチオメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 10-190)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.15-7.00 (3H, m), 4.71 (2H, s), 4.28-4.22 (2H, m), 3.72-3.68 (2H, m), 3.42 (3H, s), 2.21 (6H, s), 2.15 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性 : 油状物。

(実施例 444)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-ヒドロキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-191)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.11-6.99 (3H, m), 2.16 (6H, s), 1.67-1.55 (1H, m), 1.46 (6H, s), 0.85-0.77 (4H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 125-128°C)。

(実施例 445)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-プロピル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-192)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.13-6.99 (3H, m), 4.11 (2H, t,  $J=6.6$ ), 2.19 (6H, s), 1.90-1.70 (2H, m), 1.68-1.56 (1H, m), 1.03 (3H, t,  $J=7.2$ ), 0.88-0.78 (4H, m)。

物性 : 油状物。

(実施例 4 4 6)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-シクロプロピル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-193)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.14-6.90 (3H, m), 3.98 (2H, d,  $J=7.0$ ), 2.19 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.40-0.75 (6H, m), 0.70-0.58 (2H, m), 0.40-0.34 (2H, m)。

物性: 油状物。

(実施例 4 4 7)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(2-プロピニル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-194)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.09-7.00 (3H, m), 4.94 (2H, d,  $J=2.6$ ), 2.57 (1H, t,  $J=2.6$ ), 2.19 (6H, s), 1.70-1.54 (1H, m), 1.53 (6H, s), 0.87-0.83 (2H, m), 0.79-0.75 (2H, m)。

物性: 結晶 (融点: 103-107°C)。

(実施例 4 4 8)

3, 3-ジメチルブチリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-シアノメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-195)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.12-7.00 (3H, m), 4.91 (2H, s), 2.19 (6H, s), 2.18 (2H, s), 1.55 (6H, s), 0.81 (9H, s)。

物性: 結晶 (融点: 113-114°C)。

(実施例 4 4 9)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(3-メトキシプロピル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒ

ドロー１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－１９６）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.12-6.98 (3H, m), 4.24 (2H, t,  $J=6.0$ ), 3.59 (2H, t,  $J=6.0$ ), 3.37 (3H, s), 2.19 (6H, s), 2.12-1.98 (2H, m), 1.65-1.50 (1H, m), 1.56 (6H, s), 0.87-0.76 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例４５０)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド＝５，５－ジメチル－１－（２－メトキシ－１－メチルエチル）－２－オキソ－３－（２，６－ジメチルフェニル）－２，５－ジヒドロー１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－１９７）  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.13-6.98 (3H, m), 4.40-4.20 (1H, m), 3.64-3.54 (2H, m), 3.41 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.62-1.57 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.30 (3H, d,  $J=6.4$ ), 0.86-0.76 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例４５１)

２－メトキシベンゾイックアシッド＝５，５－ジメチル－１－（テトラヒドロフラン－３－イルメチル）－２－オキソ－３－（２，６－ジメチルフェニル）－２，５－ジヒドロー１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－１９８）  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm) : 7.66-7.46 (2H, m), 7.10-6.92 (5H, m), 4.25-4.05 (2H, m), 4.10-3.82 (2H, m), 3.82 (3H, s), 3.81-3.77 (2H, m), 2.90-2.70 (1H, m), 2.27 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.25-2.10 (1H, m), 1.85-1.70 (1H, m), 1.57 (6H, s)。

物性：結晶（融点：99-100℃）。

(実施例４５２)

２－メチルベンゾイックアシッド＝５，５－ジメチル－１－（テトラヒドロフラン－３－イルメチル）－２－オキソ－３－（２，６－ジメチルフェニル）－２，５－ジヒドロー１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－１９９）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.83-7.80 (1H, m), 7.45-7.40 (1H, m), 7.26-7.19 (2H, m), 7.01-6.96 (3H, m), 4.21-4.04 (2H, m), 3.97-3.85 (2H, m), 3.80-3.72 (2H, m), 2.80-2.75 (1H, m), 2.32 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.16-2.04 (1H, m), 1.77-1.70 (1H, m), 1.58 (6H, s)。

物性：結晶（融点：103-106°C）。

(実施例 4 5 3)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(テトラヒドロフラン-3-イル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-200）  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-7.00 (3H, m), 4.96-4.93 (1H, m), 4.17-4.02 (2H, m), 3.93-3.82 (1H, m), 2.45-2.33 (1H, m), 2.19 (3H, s), 2.18 (3H, s), 2.17-2.00 (1H, m), 1.70-1.50 (1H, m), 1.50 (6H, s), 0.88-0.75 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例 4 5 4)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-(テトラヒドロフラン-3-イル)-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-201）  
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.66-7.63 (1H, m), 7.53-7.46 (1H, m), 7.10-6.92 (5H, m), 4.99-4.96 (1H, m), 4.17 (1H, d,  $J=10.7$ ), 4.07 (1H, q,  $J=6.9$ ), 3.83-3.77 (2H, m), 3.83 (3H, s), 2.48-2.35 (1H, m), 2.27 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.20-2.00 (1H, m), 1.57 (6H, s)。

物性：結晶（融点：131-134°C）。

(実施例 4 5 5)

3-メチルオキセタン-3-カルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-202）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.17-7.00 (3H, m), 5.07 (2H, s), 4.64 (2H, d,  $J=6.2$ ), 4.30 (2H, d,  $J=6.2$ ), 3.62 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.43 (3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 5 6)

2-メトキシ-2-メチルプロピオニックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-203)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-6.98 (3H, m), 5.07 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.94 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.52 (6H, s), 1.27 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 5 7)

2-メトキシ-2-メチルプロピオニックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-209)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-6.98 (3H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.94 (3H, s), 2.21 (6H, s), 1.51 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.26 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：72-75°C)。

(実施例 4 5 8)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-221)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.41-7.24 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.81-1.67 (1H, m), 1.50 (6H, s), 1.08-0.95 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例 4 5 9)



1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-222)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.50-7.28 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.48 (6H, s), 1.24 (2H, dd,  $J=3.6, 2.9$ ), 0.83 (2H, dd,  $J=3.6, 2.9$ ).

物性: 結晶 (融点: 100-101°C)。

(実施例460)

2-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-223)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.43-7.24 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.54-1.10 (11H, m), 0.96-0.79 (2H, m)。

物性: 油状物。

(実施例461)

1-シアノシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-224)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.28 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.63 (3H, s), 1.75-1.67 (2H, m), 1.66-1.60 (2H, m), 1.57 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例462)

2, 2-ジクロロ-1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-225)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.42-7.26 (3H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.28,

2.20 (1H, d, J=7.7), 1.65-1.44 (10H, m)。

物性：油状物。

(実施例 4 6 3)

2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチルー1-メトキシメチルー2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-226)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.38-7.24 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.57 (1H, s), 1.50 (6H, s), 1.24 (6H, s), 0.98 (6H, s)。

物性：結晶 (融点：95-96°C)。

(実施例 4 6 4)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチルー1-メトキシメチルー2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-227)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.41-7.27 (3H, m), 5.04 (2H, s), 3.62 (3H, s), 2.38-1.78 (7H, m), 1.48 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 6 5)

3-メチルオキセタン-3-カルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチルー1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-228)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.42-7.28 (3H, m), 5.05 (2H, s), 4.86 (2H, d, J=6.2), 4.42 (2H, d, J=6.2), 3.62 (3H, s), 1.63 (3H, s), 1.51 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 6 6)

2-クロロアクリリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-229)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.41-7.27 (3H, m), 6.64 (1H, d,  $J=1.8$ ), 6.18 (1H, d,  $J=1.8$ ), 5.05 (2H, s), 3.63 (3H, s), 1.54 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 77-78°C)。

(実施例467)

2-クロロベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-230)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.90-7.83 (1H, m), 7.52-7.26 (6H, m), 5.07 (2H, s), 3.64 (3H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例468)

シクロプロパンルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-231)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.39-7.28 (3H, m), 5.09 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=6.9$ ), 1.76-1.68 (1H, m), 1.50 (6H, s), 1.28 (3H, t,  $J=6.9$ ), 1.09-0.88 (4H, m)。

物性: 結晶 (融点: 63-64°C)。

(実施例469)

1-メチルシクロプロパンルカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-232)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.27 (3H, m), 5.10 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=6.9$ ), 1.48 (6H, s), 1.87-1.19 (8H, m), 0.81 (2H, dd,  $J=4.8, 2.9$ )。

物性：結晶（融点：70-71℃）。

(実施例 470)

1-シアノシクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-233）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.38-7.27 (3H, m), 5.10 (2H, s), 3.88 (2H, q, J=6.9), 1.77 (2H, t, J=3.7), 1.64 (2H, t, J=3.7), 1.56 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=6.9)。

物性：油状物。

(実施例 471)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-234）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.39-7.28 (3H, m), 5.09 (2H, s), 3.87 (2H, q, J=6.9), 3.28 (1H, septet, J=8.4), 2.38-1.79 (6H, m), 1.48 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=6.9)。

物性：結晶（融点：81-82℃）。

(実施例 472)

3-メチルオキセタン-3-カルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号10-235）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.45-7.27 (3H, m), 5.10 (2H, s), 4.86 (2H, d, J=6.2), 4.42 (2H, d, J=6.2), 3.88 (2H, q, J=7.3), 1.62 (3H, s), 1.51 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.3)。

物性：油状物。

(実施例 473)

2-クロロアクリリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-

2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-236)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.28 (3H, m), 6.64 (1H, d,  $J=1.8$ ), 6.18 (1H, d,  $J=1.8$ ), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=6.9$ ), 1.54 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=6.9$ ).

物性: 結晶 (融点: 67-68°C)。

(実施例474)

ベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-237)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.05-8.06 (2H, m), 7.69-7.25 (6H, m), 5.13 (2H, s), 3.90 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例475)

2-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-238)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.00 (1H, d,  $J=7.7$ ), 7.52-7.18 (6H, s), 5.13 (2H, s), 3.99 (2H, q,  $J=6.9$ ), 2.05 (3H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=6.9$ ).

物性: 結晶 (融点: 89-90°C)。

(実施例476)

2-クロロベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-239)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.88-7.80 (1H, m), 7.49-7.26 (6H, m), 5.13 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=6.9$ ), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=6.9$ ).

物性: 結晶 (融点: 106-108°C)。

(実施例 4 7 7)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-240)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.84 (1H, dd,  $J=6.6, 1.8$ ), 7.56 (1H, m), 7.40-7.21 (3H, s), 7.08-6.94 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=6.9$ ), 3.87 (3H, s), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=6.9$ ).

物性 : 結晶 (融点 : 85-86°C)。

(実施例 4 7 8)

3-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-241)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.67-7.15 (7H, m), 5.13 (2H, s), 3.90 (2H, q,  $J=7.3$ ), 3.84 (3H, s), 1.58 (6H, s), 1.32 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性 : 油状物。

(実施例 4 7 9)

4-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-242)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 8.07-7.96 (2H, m), 7.40 (1H, d,  $J=8.4$ ), 7.32-7.24 (2H, m), 6.96-6.92 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.90 (2H, q,  $J=7.3$ ), 3.88 (3H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性 : 結晶 (融点 : 90-93°C)。

(実施例 4 8 0)

2-フルオロベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル

－2－オキソ－3－（2，4－ジクロロフェニル）－2，5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル＝エステル（化合物番号10－243）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.94-7.87 (1H, m), 7.67-7.57 (1H, m), 7.43 (1H, d,  $J=8.4$ ), 7.36-7.14 (4H, m), 5.13 (2H, s), 3.90 (2H, q,  $J=7.0$ ), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性：油状物。

(実施例481)

2，4－ジメトキシベンゾイックアシッド＝1－エトキシメトキシ－5，5－ジメチル－2－オキソ－3－（2，4－ジクロロフェニル）－2，5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル＝エステル（化合物番号10－244）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.89 (1H, d,  $J=8.8$ ), 7.41-7.22 (3H, m), 6.55-6.46 (3H, m), 5.12 (2H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.87 (3H, s), 3.85 (3H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性：油状物。

(実施例482)

2，6－ジメトキシベンゾイックアシッド＝1－エトキシメトキシ－5，5－ジメチル－2－オキソ－3－（2，4－ジクロロフェニル）－2，5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル＝エステル（化合物番号10－245）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.44-7.26 (3H, m), 6.54 (2H, d,  $J=8.4$ ), 5.12 (2H, s), 3.90 (2H, t,  $J=7.3$ ), 3.74 (6H, s), 1.59 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性：油状物。

(実施例483)

3，5－ジメトキシベンゾイックアシッド＝1－エトキシメトキシ－5，5－ジメチル－2－オキソ－3－（2，4－ジクロロフェニル）－2，5－ジヒドロ－1H－ピロール－4－イル＝エステル（化合物番号10－246）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.43-7.25 (3H, m), 7.15 (2H, d,  $J=2.2$ ), 5.13 (2H, s),

3.90 (2H, q, J=7.0), 3.82 (6H, s), 1.60 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.0)。

物性：アモルファス。

(実施例 484)

2, 4-ジフルオロベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-247)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 8.01-7.89 (1H, m), 7.42 (1H, d, J=8.4), 7.35-7.26 (2H, m), 7.03-6.88 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.90 (2H, q, J=7.0), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 485)

ニコチン酸アシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-248)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 9.25 (1H, d, J=1.5), 8.86 (1H, dd, J=4.8, 1.8), 8.28 (1H, dt, J=8.1, 1.8), 7.49-7.27 (4H, m), 5.13 (2H, s), 3.90 (2H, q, J=7.0), 1.59 (6H, s), 1.31 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 486)

2-メトキシニコチン酸アシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-249)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 8.39 (1H, dd, J=5.1, 2.2), 8.18 (1H, dd, J=7.7, 1.8), 7.43-7.25 (3H, m), 6.99 (1H, dd, J=7.7, 5.1), 5.13 (2H, s), 4.02 (3H, s), 3.90 (2H, q, J=7.0), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。



(実施例 487)

シクロプロパンルカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-250)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.24 (3H, m), 4.30 (2H, t,  $J=3.2$ ), 3.71 (2H, t,  $J=3.2$ ), 3.43 (3H, s), 1.82-1.69 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.06-0.95 (4H, m)。

物性: 結晶 (融点: 85-86°C)。

(実施例 488)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-251)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.41-7.25 (3H, m), 4.30 (2H, t,  $J=3.2$ ), 3.71 (2H, t,  $J=3.2$ ), 3.43 (3H, s), 3.28 (1H, septet,  $J=8.4$ ), 2.33-1.81 (6H, m), 1.49 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 489)

ベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-252)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.05-8.00 (2H, m), 7.69-7.25 (6H, m), 4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: アモルファス。

(実施例 490)

2-メチルベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロ

ールー４－イル＝エステル（化合物番号１０－２５３）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.99 (1H, d,  $J=7.7$ ), 7.53-7.25 (6H, m), 4.36-4.31 (2H, m), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 2.44 (3H, s), 1.59 (6H, s)。

物性：結晶（融点：89-90°C）。

（実施例４９１）

２－メトキシベンゾイックアシッド＝５，５－ジメチルー１－メトキシエトキシ－２－オキソ－３－（２，４－ジクロロフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－２５４）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.87-7.81 (1H, m), 7.60-7.51 (1H, m), 7.42-7.24 (3H, m), 7.08-6.97 (2H, m), 4.35-4.31 (2H, m), 3.87 (3H, s), 3.75-3.70 (2H, m), 3.44 (3H, s), 1.58 (6H, s)。

物性：油状物。

（実施例４９２）

ニコチン酸アシッド＝５，５－ジメチルー１－メトキシエトキシ－２－オキソ－３－（２，４－ジクロロフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－２５５）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 9.24 (1H, d,  $J=1.8$ ), 8.86 (1H, dd,  $J=4.8, 1.5$ ), 8.27 (1H, dt,  $H=7.7, 1.8$ ), 7.49-7.27 (4H, m), 4.37-4.32 (2H, m), 3.75-3.71 (2H, m), 3.45 (3H, s), 1.60 (6H, s)。

物性：油状物。

（実施例４９３）

シクロプロパンカルボキシリックアシッド＝５，５－ジメチルー１－メトキシメトキシ－２－オキソ－３－（２－クロロフェニル）－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－４－イル＝エステル（化合物番号１０－２５６）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.42-7.24 (5H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.76-1.65 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.04-0.90 (4H, m)。

物性：油状物。

(実施例 4 9 4)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-257)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.25 (5H, m), 5.05 (2H, s), 3.62 (3H, s), 1.49 (6H, s), 1.30 (3H, s), 1.26-1.14 (2H, m), 0.86-0.75 (2H, m)。

物性：油状物。

(実施例 4 9 5)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-258)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.83 (1H, dd,  $J=8.0, 1.8$ ), 7.58-7.19 (5H, m), 7.03-6.95 (2H, m), 5.08 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.64 (3H, s), 1.57 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 4 9 6)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-259)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.22 (4H, m), 5.10 (2H, s), 3.88 (2H, t,  $J=7.0$ ), 1.79-1.66 (1H, m), 1.51 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.04-0.89 (4H, m)。

物性：結晶 (融点: 97-99°C)。

(実施例 4 9 7)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5,5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒド

ロー 1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-260)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40-7.24 (4H, m), 5.10 (2H, s), 3.88 (2H, q,  $J=7.3$ ), 1.49 (6H, s), 1.30 (3H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.3$ ), 1.23-1.18 (2H, m), 0.80-0.74 (2H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 94-96°C)。

(実施例 498)

1-シアノシクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロロー 1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-261)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.44-7.28 (4H, m), 5.11 (2H, s), 3.89 (2H, t,  $J=7.0$ ), 1.78-1.54 (4H, m), 1.57 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性 : 油状物。

(実施例 499)

シクロブタンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロロー 1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-262)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40-7.22 (4H, m), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, t,  $J=7.0$ ), 3.34-3.13 (1H, m), 2.36-1.75 (6H, m), 1.49 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性 : 結晶 (融点 : 103-105°C)。

(実施例 500)

シクロペンタンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロロー 1 H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-263)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40-7.22 (4H, m), 5.11 (2H, s), 3.88 (2H, t,  $J=7.0$ ), 2.95-2.75 (1H, m), 1.95-1.54 (8H, m), 1.50 (6H, s), 1.29 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性 : 結晶 (融点 : 107-108°C)。

(実施例 501)

3-メチルオキセタン-3-カルボキシリクアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-264)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.41-7.27 (4H, m), 5.11 (2H, s), 4.83 (2H, d,  $J=6.2$ ), 4.38 (2H, d,  $J=6.2$ ), 3.89 (2H, d,  $J=7.0$ ), 1.60 (3H, s), 1.52 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 126-129°C)。

(実施例 502)

2-メチルベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-265)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.01-7.97 (1H, m), 7.50-7.18 (7H, m), 5.14 (2H, s), 3.90 (2H, t,  $J=7.0$ ), 2.64 (3H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 503)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-266)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.02 (1H, dd,  $J=7.7, 1.8$ ), 7.82 (1H, dd,  $J=7.7, 1.8$ ), 7.60-6.95 (6H, m), 5.13 (2H, s), 3.90 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.86 (3H, s), 3.85 (3H, s), 1.58 (6H, s), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 504)

チオホスホンニックアシッド=O, O'-ジエチルエステル=O'-[1-エトキシ

メチル-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル] エステル (化合物番号10-267)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.46-7.24 (4H, m), 5.09 (2H, s), 4.12-3.45 (6H, m), 1.55 (6H, s), 1.29 (6H, t,  $J=7.0$ ), 1.08 (3H, brd. t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例505)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-268)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.42-7.21 (4H, m), 4.33-4.28 (2H, m), 3.74-3.69 (2H, m), 3.43 (3H, s), 1.79-1.66 (1H, m), 1.52 (6H, s), 1.06-0.93 (4H, m).

物性: 油状物。

(実施例506)

1-メチルシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-269)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.40-7.25 (4H, m), 4.33-4.28 (2H, m), 3.74-3.69 (2H, m), 3.43 (3H, s), 1.50 (6H, s), 1.29 (3H, s), 1.23-1.18 (2H, m), 0.80-0.74 (2H, m).

物性: 油状物。

(実施例507)

1-シアノシクロプロパンカルボキシリックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-270)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.44-7.25 (4H, m), 4.34-4.30 (2H, m), 3.74-3.69 (2H, m), 3.44 (3H, s), 1.77-1.51 (4H, m), 1.58 (6H, s).

物性：油状物。

(実施例 508)

シクロブタンカルボキシリクアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-271)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40-7.25 (4H, m), 4.33-4.28 (2H, m), 3.74-3.69 (2H, m), 3.43 (3H, s), 3.35-3.15 (1H, m), 2.35-1.75 (6H, m), 1.50 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 509)

シクロペンタンカルボキシリクアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-272)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.40-7.22 (4H, m), 4.33-4.28 (2H, m), 3.74-3.69 (2H, m), 3.43 (3H, s), 2.89-2.78 (1H, m), 1.92-1.54 (8H, m), 1.50 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 510)

3-メチルオキセタン-3-カルボキシリクアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロロール-4-イル=エステル (化合物番号 10-273)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.41-7.25 (4H, m), 4.82 (2H, d,  $J=6.2$ ), 4.38 (2H, d,  $J=6.2$ ), 4.34-4.30 (2H, m), 3.74-3.69 (2H, m), 3.44 (3H, s), 1.59 (3H, s), 1.52 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 511)

2-メチルベンゾイックアシッド=5, 5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-

2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-274)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 8.01-7.97 (1H, m), 7.51-7.42 (2H, m), 7.35-7.19 (5H, m), 4.37-4.32 (2H, m), 3.76-3.72 (2H, m), 3.45 (3H, s), 2.41 (3H, s), 1.59 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例512)

2-メトキシベンゾイックアシッド=5,5-ジメチル-1-メトキシエトキシ-2-オキソ-3-(2-クロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号10-275)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.85-7.80 (1H, m), 7.57-7.21 (5H, m), 7.02-6.95 (3H, m), 4.36-4.31 (2H, m), 3.85 (3H, s), 3.76-3.71 (2H, m), 3.44 (3H, s), 1.58 (6H, s)。

物性: 油状物。

(実施例513)

5-(2-[1,3]ジオキサソ-2-イルエチル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号11-1)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.18-7.02 (3H, m), 5.00 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 4.55-4.47 (1H, m), 4.08-3.95 (2H, m), 3.77-3.60 (2H, m), 3.58 (3H, s), 2.20 (3H, s), 2.17 (3H, s), 2.15-1.20 (6H, m), 1.53 (3H, s)。

物性: 油状物。

(実施例514)

4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-5-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号11-2)



$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.15-7.00 (3H, m), 5.04 (2H, ABq,  $J=7.7$ ), 4.30-4.13 (1H, m), 4.05-3.87 (2H, m), 3.55 (3H, s), 2.60-1.50 (6H, m), 2.20 (6H, s), 1.61 (3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 5 1 5)

5-アリル-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1 1-3)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.43 (1H, s), 7.16-6.98 (3H, s), 5.76-5.56 (1H, m), 5.19-5.03 (2H, m), 4.90 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 3.48 (3H, s), 2.56 (2H, m), 2.07 (6H, s), 1.43 (3H, s)。

物性：結晶 (融点: 136-139°C)。

(実施例 5 1 6)

5-ベンジル-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1 1-4)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.50 (1H, s), 7.38-6.79 (8H, m), 5.05 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 3.56 (3H, s), 3.09 (2H, ABq,  $J=13.5$ ), 2.02 (3H, s), 1.55 (3H, s), 1.18 (3H, s)。

物性：結晶 (融点: 167-168°C)。

(実施例 5 1 7)

5-シクロヘキシルメチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2, 5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1 1-5)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.42 (1H, s), 7.17-7.01 (3H, m), 4.88 (2H, ABq,  $J=7.6$ ), 3.46 (3H, s), 2.26 (1H, t,  $J=4.7$ ), 2.13 (3H, s), 2.07 (3H, s), 1.85-0.80

(15H, m)。

物性：結晶（融点：174-176℃）。

(実施例 5 1 8)

4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-5-フェネチル-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール  
(化合物番号 1 1-6)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm) : 11.60 (1H, s), 7.33-7.05 (8H, m), 4.97 (2H, ABq, J=7.6), 3.48 (3H, s), 2.16 (3H, s), 2.11 (3H, s), 2.78-1.97 (4H, m), 1.44 (3H, s)。

物性：結晶（融点：194-195℃）。

(実施例 5 1 9)

4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(2-メトキシエチル)-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 1 1-7)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm) : 11.53 (1H, s), 7.14-7.02 (3H, m), 4.89 (2H, ABq, J=7.3), 3.47 (3H, s), 3.46-3.25 (2H, m), 3.18 (3H, s), 2.22-2.00 (8H, m), 1.42 (3H, s)。

物性：結晶（融点：105.0-105.5℃）。

(実施例 5 2 0)

4-ヒドロキシ-8-オキサ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4.5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 1 1-8)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.22-7.07 (3H, m), 6.92 (1H, s), 5.05 (2H, s), 4.03-3.98 (4H, m), 3.62 (3H, s), 2.49-2.37 (2H, m), 2.18 (6H, s), 1.90-1.75 (2H, m)。

物性：結晶（融点：177-180℃）。

(実施例 5 2 1)

2-メチルベンゾイックアシッド=8-オキサー3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4.5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号11-9)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.54-7.45 (2H, m), 7.11-6.90 (5H, m), 5.13 (2H, s), 4.10-3.87 (4H, m), 3.84 (3H, s), 3.66 (3H, s), 2.51-2.38 (2H, m), 2.26 (6H, s), 2.01-1.94 (2H, m)。

物性: 結晶 (融点: 129-130°C)。

#### (実施例522)

5-(4-クロロベンジル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号11-10)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.34 (2H, d,  $J=8.4$ ), 7.26 (2H, d,  $J=8.4$ ), 7.06-6.84 (3H, m), 5.07 (2H, ABq,  $J=7.7$ ), 3.95-3.71 (2H, m), 3.07 (2H, ABq,  $J=13.5$ ), 2.02 (6H, m), 1.52 (3H, m), 1.23 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: 結晶 (融点: 186-190°C)。

#### (実施例523)

5-(2-クロロベンジル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-エトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号11-11)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.45 (1H, brd. s), 7.64-7.59 (1H, m), 7.39-7.32 (1H, m), 7.25-7.15 (2H, m), 7.08-6.87 (3H, m), 5.07 (2H, q,  $J=7.3$ ), 3.88-3.74 (2H, m), 3.29 (2H, ABq,  $J=14.6$ ), 2.02 (6H, s), 1.57 (3H, s), 1.18 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性: 結晶 (融点: 130-134°C)。

#### (実施例524)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=1-エトキシメチル-3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4.4]ノナン-3-エン-2-オン-

4-イル=エステル (化合物番号 11-12)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.16-6.99 (3H, m), 5.18 (2H, s), 3.93 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.03-2.86 (2H, m), 2.51-2.40 (2H, m), 2.18 (6H, s), 2.03-1.83 (2H, m), 1.74-1.61 (1H, m), 1.32 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.95-0.81 (3H, m)。

物性: 結晶 (融点: 115-116°C)。

(実施例 525)

5-エチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-13)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.84 (1H, brd. s), 7.65 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.43 (1H, dd,  $J=8.4, 2.2$ ), 7.28 (1H, d,  $J=8.4$ ), 4.88 (2H, ABq,  $J=7.7$ ), 3.46 (3H, s), 1.79 (2H, q,  $J=7.3$ ), 1.39 (3H, s), 0.75 (3H, t,  $J=7.3$ )。

物性: 結晶 (融点: 122-127°C)。

(実施例 526)

4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(4-メトキシベンジル)-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-14)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.48 (1H, m), 7.29 (1H, dd,  $J=8.4, 2.6$ ), 7.16 (2H, d,  $J=8.8$ ), 6.85-6.72 (3H, m), 4.97 (2H, ABq,  $J=7.7$ ), 3.69 (3H, s), 3.53 (3H, s), 2.99 (2H, ABq,  $J=13.6$ ), 1.47 (3H, s)。

物性: 油状物。

(実施例 527)

4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(3-メチルベンジル)-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-15)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.51 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.31 (1H, dd,  $J=8.4, 2.2$ ),

7.13-6.68 (5H, m), 4.98 (2H, ABq, J=7.3), 3.54 (3H, s), 3.05 (2H, ABq, J=13.6), 2.21 (3H, s), 1.51 (3H, s)。

物性：結晶（融点：128-132℃）。

(実施例 5 2 8)

4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(3-メトキシベンジル)-1-メトキシメトキシ-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール（化合物番号 11-16）

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm) : 7.51 (1H, d, J=1.8), 7.30 (1H, dd, J=8.8, 2.2), 7.11 (1H, t, J=8.8), 6.86-6.71 (4H, m), 5.00 (2H, ABq, J=7.7), 3.67 (3H, s), 3.54 (3H, s), 3.06 (2H, ABq, J=13.6), 1.52 (3H, s)。

物性：油状物。

(実施例 5 2 9)

1-エトキシメトキシ-5-エチル-4-ヒドロキシ-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール（化合物番号 11-17）

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  (ppm) : 11.82 (1H, brd. s), 7.65 (1H, d, J=2.2), 7.43 (1H, dd, J=8.4, 2.2), 7.28 (1H, d, J=8.4), 4.92 (2H, ABq, J=8.4), 3.74 (2H, q, J=7.0), 1.79 (2H, q, J=7.3), 1.39 (3H, s), 1.17 (3H, t, J=7.0), 0.75 (3H, t, J=7.3)。

物性：結晶（融点：145-148℃）。

(実施例 5 3 0)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5-エチル-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号 11-18）

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.83 (1H, dd, J=8.0, 1.8), 7.60-7.51 (1H, m), 7.43 (1H, d, J=8.4), 7.34 (1H, d, J=1.8), 7.27 (1H, dd, J=8.0, 1.8), 7.05-6.97 (2H, m), 5.12 (2H, s), 3.87 (2H, q, J=7.0), 3.87 (3H, s), 2.08-1.73 (2H, m), 1.56 (3H,

s), 1.29 (3H, t, J=7.0), 0.94 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 5 3 1)

1-エトキシメトキシ-5-イソプロピル-4-ヒドロキシ-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-19)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm) : 11.74 (1H, brd. s), 7.64 (1H, d, J=1.8), 7.42 (1H, dd, J=8.0, 1.8), 7.27 (1H, d, J=8.0), 4.95 (2H, s), 3.80-3.68 (2H, m), 2.21-2.08 (1H, m), 1.43 (3H, s), 1.15 (3H, t, J=7.3), 1.03 (3H, d, J=7.3), 0.91 (3H, d, J=7.3)。

物性：ゴム状。

(実施例 5 3 2)

1-エトキシメチル-4-ヒドロキシ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-1-アザスピロ[4.4]ノナン-3-エン-2-オン (化合物番号 11-20)

<sup>1</sup>H-NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) δ (ppm) : 7.64 (1H, d, J=2.2), 7.41 (1H, dd, J=8.0, 2.2), 7.28 (1H, d, J=8.0), 5.02 (2H, s), 3.82 (2H, q, J=7.3), 2.75-2.55 (2H, m), 2.45-2.25 (2H, m), 2.05-1.70 (2H, m), 1.21 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶 (融点：143-148℃)。

(実施例 5 3 3)

1,4-ビス(エトキシメチル)-3-(2,4-ジクロロフェニル)-1-アザスピロ[4.4]ノナン-3-エン-2-オン (化合物番号 11-21)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.44-7.42 (1H, m), 7.30-7.21 (2H, m), 5.14 (2H, s), 4.97 (2H, ABq, J=5.5), 3.99-3.85 (2H, m), 3.73-3.62 (2H, m), 2.98-2.78 (2H, m), 2.55-2.35 (2H, m), 2.13-1.78 (2H, m), 1.31 (3H, t, J=7.0), 1.19 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶 (融点：98-103℃)。

(実施例 5 3 4)

1-エトキシメトキシ-5-(2-クロロベンジル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-22)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.53-7.17 (7H, m), 5.02 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 3.79 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.26 (2H, ABq,  $J=14.2$ ), 1.53 (3H, s), 1.17 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 5 3 5)

1-エトキシメトキシ-5-(3-クロロベンジル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-23)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)$   $\delta$  (ppm): 7.53 (1H, d,  $J=1.8$ ), 7.36-7.24 (6H, m), 5.05 (2H, ABq,  $J=7.7$ ), 3.92-3.72 (2H, m), 3.11 (2H, ABq,  $J=13.9$ ), 1.53 (3H, s), 1.22 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 5 3 6)

1-エトキシメトキシ-5-(4-クロロベンジル)-4-ヒドロキシ-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-24)

$^1\text{H-NMR}(\text{DMSO}-d_6)$   $\delta$  (ppm): 7.51 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.34-7.13 (6H, m), 6.80 (1H, brd. s), 5.04 (2H, ABq,  $J=7.7$ ), 3.90-3.73 (2H, m), 3.08 (2H, ABq,  $J=17.0$ ), 1.51 (3H, s), 1.22 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 5 3 7)

2-メトキシベンゾイックアシッド=1-エトキシメトキシ-5-(4-クロロベンジル)-5-メチル-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,

5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル (化合物番号 11-25)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.73 (1H, dd,  $J=8.0, 1.8$ ), 7.62-7.53 (1H, m), 7.31-7.00 (9H, m), 5.26 (2H, s), 3.93 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.91 (3H, s), 3.35 (1H, d,  $J=13.9$ ), 3.02 (1H, d,  $J=13.9$ ), 1.58 (3H, s), 1.33 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 油状物。

(実施例 538)

1-エトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(2-メチルベンジル)-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-26)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.51 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.42-7.27 (2H, m), 7.09-6.96 (4H, m), 5.02 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 3.80 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.33 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.18 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: 結晶 (融点: 137-141°C)。

(実施例 539)

1-エトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(3-メチルベンジル)-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-27)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.50 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.30 (1H, dd,  $J=8.4, 2.2$ ), 7.13-6.68 (5H, m), 5.02 (2H, ABq,  $J=7.3$ ), 3.99-3.76 (2H, m), 3.04 (2H, ABq,  $J=13.6$ ), 2.21 (3H, s), 1.50 (3H, s), 1.21 (3H, t,  $J=7.3$ ).

物性: 油状物。

(実施例 540)

1-エトキシメトキシ-4-ヒドロキシ-5-メチル-5-(4-メトキシベンジル)-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール (化合物番号 11-28)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  (ppm): 7.48 (1H, d,  $J=2.2$ ), 7.29 (1H, dd,  $J=8.0, 2.2$ ), 7.17



(2H, d, J=8.8), 6.77-6.72 (3H, m), 5.01 (2H, ABq, J=7.7), 3.89-3.73 (2H, m), 3.69 (3H, s), 3.00 (2H, ABq, J=13.9), 1.47 (3H, s), 1.21 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶（融点：73-77℃）。

(実施例 5 4 1)

炭酸=エチル=エステル=1-エトキシメトキシ-5-メチル-5-(4-メトキシベンジル)-2-オキソ-3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-4-イル=エステル（化合物番号11-29）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.45-7.28 (5H, m), 6.90 (2H, d, J=8.8), 4.84 (2H, ABq, J=7.3), 3.86-3.47 (8H, m), 1.97 (3H, s), 1.06 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 5 4 2)

3-(2,6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-8-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン（化合物番号11-30）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 11.42 (1H, s), 7.15-7.04 (3H, m), 4.64 (2H, s), 3.80 (3H, s), 3.80-3.68 (1H, m), 3.28 (3H, s), 2.08 (6H, s), 2.10-1.78 (8H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 5 4 3)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-メトキシ-8-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号11-31）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 4.74, 4.72 (2H, s, s), 4.03, 4.00 (3H, s, s), 3.88-3.72 (1H, m), 3.42, 3.40 (3H, s, s), 2.20 (6H, s), 2.25-1.50 (9H, m), 0.86-0.71 (4H, m)。

物性：アモルファス。

(実施例 5 4 4)

8-エトキシメトキシ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 1 1-3 2)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.77 (1H, brd. s), 7.19-7.03 (3H, m), 4.13 (2H, brd. s), 3.96, 3.92 (3H, s, s), 3.75-3.60 (1H, m), 3.38 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.17 (6H, s), 2.17-1.85 (8H, m), 1.16 (3H, t,  $J=7.0$ ).

物性: アモルファス。

(実施例 5 4 5)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=8-エトキシメトキシ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-メトキシ-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 1 1-3 6)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.15-7.00 (3H, m), 4.77 (2H, s), 4.00 (3H, s), 3.88-3.75 (1H, m), 3.64 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.20 (6H, s), 2.19-1.53 (9H, m), 1.24 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.89-0.76 (4H, m).

物性: 油状物。

(実施例 5 4 6)

アセティックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-メトキシ-8-(N-メトキシイミノ)-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 1 1-3 8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  (ppm): 7.15-6.98 (3H, m), 4.03 (3H, s), 3.87 (3H, s), 2.87-2.44 (4H, m), 2.30-1.95 (4H, m), 2.20 (6H, s), 2.00 (3H, s).

物性: 結晶 (融点: 156-160°C)。

(実施例 5 4 7)

プロピオニックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-メトキシ-8-(N-メトキシイミノ)-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-

オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-39)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-6.98 (3H, m), 4.03 (3H, s), 3.87 (3H, s), 2.95-2.45 (4H, m), 2.26 (2H, q,  $J=7.7$ ), 2.35-2.00 (4H, m), 2.20 (6H, s), 0.92 (3H, t,  $J=7.7$ ).

物性: 結晶 (融点: 74-76°C)。

(実施例 548)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-メトキシ-8-(N-メトキシイミノ)-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-41)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-7.00 (3H, m), 4.03 (3H, s), 3.88 (3H, s), 2.97-2.47 (4H, m), 2.34-1.98 (4H, m), 2.20 (6H, s), 1.64-1.50 (1H, m), 0.90-0.80 (2H, m), 0.78-0.68 (2H, m)。

物性: 油状物。

(実施例 549)

8,8-エチレンジオキシ-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 11-42)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.78 (1H, brd. s), 7.19-7.04 (3H, m), 3.95 (3H, s), 3.87 (2H, t,  $J=6.2$ ), 3.33 (2H, t,  $J=6.2$ ), 2.50-1.75 (8H, m), 2.04 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 197-198°C)。

(実施例 550)

アセティックアシッド=8,8-エチレンジオキシ-1-メトキシ-3-(2,6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4,5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-43)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-7.00 (3H, m), 4.03 (3H, s), 4.02-3.96 (4H, m), 2.20 (6H, s), 2.25-1.84 (8H, m), 2.01 (3H, s)。

物性：結晶（融点：99-101℃）。

(実施例 5 5 1)

プロピオニックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-メトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-4 4）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.99 (3H, m), 4.03 (3H, s), 4.01-3.96 (4H, m), 2.29 (2H, q,  $J=7.4$ ), 2.20 (6H, s), 2.23-1.58 (8H, m), 0.94 (3H, t,  $J=7.4$ )。

物性：油状物。

(実施例 5 5 2)

2-メチルプロピオニックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-メトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-4 5）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.98 (3H, m), 4.03 (3H, s), 4.01-3.98 (4H, m), 2.52 (1H, quintet,  $J=7.0$ ), 2.34-1.83 (8H, m), 2.20 (6H, s), 0.95 (6H, d,  $J=7.0$ )。

物性：結晶（融点：123-126℃）。

(実施例 5 5 3)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-メトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-4 6）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.18-6.98 (3H, m), 4.02 (4H, d,  $J=2.6$ ), 2.19 (6H, s), 2.30-1.82 (9H, m), 0.88-0.71 (4H, m)。

物性：結晶（融点：130-133℃）。

(実施例 5 5 4)

3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシ-8, 8-プロピレンジオキシー-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン（化

化合物番号 1 1 - 4 7)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.19-7.05 (3H, m), 4.02, 3.94 (3H, s, s), 3.93-3.85 (2H, m), 3.35-3.33 (2H, m), 2.36-1.56 (10H, m), 2.17 (6H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 185-187°C) 。

(実施例 5 5 5)

アセティックアシッド = 3 - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 1 - メトキシ - 8, 8 - プロピレンジオキシー - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 2 - オン - 4 - イル = エステル (化合物番号 1 1 - 4 8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 4.02 (3H, s), 4.00-3.90 (4H, m), 2.24-1.71 (10H, m), 2.19 (6H, s), 2.00 (3H, s)。

物性 : 結晶 (融点 : 153-156°C) 。

(実施例 5 5 6)

プロピオニックアシッド = 3 - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 1 - メトキシ - 8, 8 - プロピレンジオキシー - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 2 - オン - 4 - イル = エステル (化合物番号 1 1 - 4 9)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-7.00 (3H, m), 4.02 (3H, s), 4.00-3.89 (4H, m), 2.27 (2H, q,  $J=7.7$ ), 2.20 (6H, s), 2.20-1.71 (10H, m), 0.93 (3H, t,  $J=7.7$ )。

物性 : ガム状。

(実施例 5 5 7)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド = 3 - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 1 - メトキシ - 8, 8 - プロピレンジオキシー - 1 - アザスピロ [4, 5] デカン - 3 - エン - 2 - オン - 4 - イル = エステル (化合物番号 1 1 - 5 1)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.98 (3H, m), 4.02 (3H, s), 4.00-3.91 (4H, m), 2.19 (6H, s), 2.22-1.50 (11H, m), 0.88-0.72 (4H, m)。

物性 : 結晶 (融点 : 145-147°C) 。

(実施例 5 5 8)

1, 8-ビス (メトキシメトキシ) - 3 - (2, 6-ジメチルフェニル) - 4-ヒドロキシ-1-アザスピロ [4, 5] デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 1 1 - 5 2)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  (ppm): 11.55-11.45 (1H, m), 7.15-7.04 (3H, m), 4.93, 4.90 (2H, s, s), 4.65, 4.64 (2H, s, s), 3.80-3.50 (1H, m), 3.49, 3.47 (3H, s, s), 3.29, 3.27 (3H, s, s), 2.45-1.55 (8H, m), 2.08 (6H, s)。

物性: ガム状。

(実施例 5 5 9)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=1, 8-ビス (メトキシメトキシ) - 3 - (2, 6-ジメチルフェニル) - 1-アザスピロ [4, 5] デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 1 1 - 5 3)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 7.16-6.96 (3H, m), 5.09, 5.07 (2H, s, s), 4.72, 4.71 (2H, s, s), 3.95-3.60 (1H, m), 3.64, 3.61 (3H, s, s), 3.41, 3.40 (3H, s, s), 2.55-1.50 (9H, m), 2.19 (6H, s), 0.85-0.76 (4H, m)。

物性: アモルファス。

(実施例 5 6 0)

8-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ [4, 5] デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 1 1 - 5 4)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm): 8.17 (1H, brd. s), 7.20-7.04 (3H, m), 5.03, 4.99 (3H, s, s), 4.00 (2H, s), 3.61, 3.57 (3H, s), 3.65-3.50 (1H, m), 3.32 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.48-1.80 (8H, m), 2.16 (6H, s), 1.15 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性: アモルファス。

(実施例 5 6 1)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=8-エトキシメトキシ-3-(2,

6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-55)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.15-7.00 (3H, m), 5.06 (2H, s), 4.77 (2H, s), 3.75-3.60 (1H, m), 3.64 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.61 (3H, s), 2.19 (6H, s), 2.30-1.54 (8H, m), 1.24 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.89-0.73 (4H, m)。

物性: 油状物。

(実施例 562)

8, 8-エチレンジオキシ-4-ヒドロキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 11-56)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.43 (1H, brd. s), 7.20-7.01 (3H, m), 5.03 (2H, s), 3.89 (2H, t,  $J=6.2$ ), 3.61 (3H, s), 3.50 (2H, t,  $J=6.2$ ), 2.60-1.70 (8H, m), 2.19 (6H, s)。

物性: 結晶 (融点: 188-189°C)。

(実施例 563)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=8, 8-エチレンジオキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-57)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-6.99 (3H, m), 5.08 (2H, s), 4.00 (4H, s), 3.64 (3H, s), 2.55-2.49 (2H, m), 2.19 (6H, s), 2.02-1.89 (6H, m), 0.85-0.72 (4H, m)。

物性: 結晶 (融点: 140-142°C)。

(実施例 564)

2-メチルプロピオンックアシッド=8, 8-エチレンジオキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-58)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.14-6.98 (3H, m), 5.08 (2H, s), 3.98 (4H, s), 3.64 (3H,

s), 2.58-2.39 (3H, m), 2.20 (6H, s), 1.96-1.91 (6H, m), 0.95 (6H, d, J=7.0)。

物性：結晶（融点：135-137℃）。

(実施例 5 6 5)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-5 9）

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.14-6.97 (3H, m), 5.08 (2H, s), 3.98 (4H, s), 3.64 (3H, s), 2.58-2.41 (2H, m), 2.20 (6H, s), 1.94-1.89 (6H, m), 1.01 (9H, s)。

物性：結晶（融点：181-182℃）。

(実施例 5 6 6)

炭酸=エチル=エステル=8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-6 0）

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.13-7.00 (3H, m), 5.08 (2H, s), 3.99 (4H, s), 3.94 (2H, q, J=7.0), 3.64 (3H, s), 2.56-2.40 (2H, m), 2.20 (6H, s), 2.04-1.92 (6H, m), 1.01 (3H, t, J=7.0)。

物性：結晶（融点：82-83℃）。

(実施例 5 6 7)

シクロプロパンカルボキリシックアシッド=3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシメトキシ-8, 8-プロピレンジオキシー-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-6 1）

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.15-7.00 (3H, m), 5.07 (2H, s), 3.99-3.91 (4H, m), 3.61 (3H, s), 2.50-1.51 (11H, m), 2.19 (6H, s), 0.84-0.71 (4H, m)。

物性：結晶（融点：125-127℃）。

(実施例 5 6 8)



シクロプロパンカルボキリシクアシッド=1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-8-メトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-62)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-7.00 (3H, m), 5.12 (2H, s), 4.73 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.80-3.60 (1H, m), 3.40 (3H, s), 2.20 (6H, s), 2.30-1.56 (9H, m), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.87-0.74 (4H, m)。

物性: 結晶 (融点: 56-59°C)。

#### (実施例 569)

シクロプロパンカルボキリシクアシッド=1, 8-ビス (エトキシメトキシ)-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-63)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.16-7.00 (3H, m), 5.12 (2H, s), 4.77 (2H, s), 3.87 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.64 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.80-3.60 (1H, m), 2.19 (6H, s), 2.30-1.56 (8H, m), 1.28 (3H, t,  $J=7.0$ ), 1.24 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.86-0.77 (4H, m)。

物性: 油状物。

#### (実施例 570)

シクロプロパンカルボキリシクアシッド=1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-8-(N-メトキシイミノ)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-64)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 7.17-7.00 (3H, m), 5.14 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.84 (2H, q,  $J=7.0$ ), 3.20-3.00 (1H, m), 2.74-2.00 (8H, m), 2.19 (6H, s), 1.26 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.85-0.72 (4H, m)。

物性: 油状物。

#### (実施例 571)

8, 8-エチレンジオキシ-1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オ

ン (化合物番号 1 1 - 6 5)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 11.59 (1H, s), 7.18-6.98 (3H, m), 4.95 (2H, s), 3.90 (4H, s), 3.77 (2H, q,  $J=7.1$ ), 2.40-1.70 (8H, m), 2.08 (6H, s), 1.18 (3H, t,  $J=7.1$ )。

物性 : 結晶 (融点 : 161-163°C)。

(実施例 5 7 2)

プロピオン尼克アシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 1 1 - 6 6)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.15-6.99 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.99 (4H, s), 3.89 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.57-2.37 (2H, m), 2.28 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.20 (6H, s), 1.96-1.85 (6H, m), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.93 (3H, t,  $J=7.0$ )。

物性 : 油状物。

(実施例 5 7 3)

2-メチルプロピオン尼克アシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 1 1 - 6 7)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-6.99 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.98 (4H, s), 3.90 (2H, q,  $J=7.0$ ), 2.60-2.40 (3H, m), 2.20 (6H, s), 1.96-1.91 (6H, m), 1.30 (3H, t,  $J=7.0$ ), 0.95 (6H, d,  $J=7.0$ )。

物性 : 結晶 (融点 : 136-141°C)。

(実施例 5 7 4)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 1 1 - 6 8)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 5.13 (2H, s), 4.00 (4H, s), 3.89 (2H,

q, J=7.3), 2.55-1.85 (9H, m), 2.19 (6H, s), 1.30 (3H, t, J=7.3), 0.85-0.74 (4H, m)。

物性：結晶（融点：114-116℃）。

(実施例 5 7 5)

2, 2-ジメチルプロピオニックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-1-エトキシメトキシ-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-6 9）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-6.97 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.97 (4H, s), 3.90 (2H, q, J=7.0), 2.61-2.43 (2H, m), 1.96-1.85 (6H, m), 1.30 (3H, t, J=7.0), 1.01 (9H, s)。

物性：結晶（融点：168-173℃）。

(実施例 5 7 6)

炭酸=エチル=エステル=8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-エトキシメトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル（化合物番号 1 1-7 0）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.16-7.00 (3H, m), 5.13 (2H, s), 3.99 (4H, s), 3.94 (2H, t, J=7.0), 3.90 (2H, t, J=7.0), 2.60-2.51 (2H, m), 2.20 (6H, s), 2.01-1.92 (6H, m), 1.30 (3H, t, J=7.0), 1.01 (3H, t, J=7.0)。

物性：油状物。

(実施例 5 7 7)

8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシー-1-メトキシエトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン（化合物番号 1 1-7 1）

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm) : 7.14-7.06 (3H, m), 4.26-4.10 (2H, m), 3.98-3.88 (2H, m), 3.72-3.67 (2H, m), 3.60-3.40 (1H, m), 3.42 (3H, s), 2.45-1.80 (9H, m), 2.18 (6H, s)。

物性：アモルファス。

(実施例 578)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシエトキシー-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-74)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.15-7.00 (3H, m), 4.36 (2H, t, J=4.4), 4.01 (4H, s), 3.72 (2H, t, J=4.4), 3.44 (3H, s), 2.30-1.55 (9H, m), 0.85-0.73 (4H, m)。

物性：結晶 (融点：77-79℃)。

(実施例 579)

2-メトキシベンゾイックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-メトキシ-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-77)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 8.23-8.18 (2H, m), 7.15-6.86 (5H, m), 4.06 (3H, s), 4.02-3.90 (4H, m), 3.84 (3H, s), 2.38-1.98 (8H, m), 2.25 (6H, s)。

物性：油状物。

(実施例 580)

1, 8-ビス(エトキシメトキシ)-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシー-1-アザスピロ[4, 5]デカン-3-エン-2-オン (化合物番号 11-78)

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm) : 7.83 (1H, brd. s), 7.20-7.06 (3H, m), 5.09, 5.06 (2H, s, s), 4.17-4.06 (2H, m), 3.83 (2H, q, J=7.0), 3.70-3.50 (1H, m), 3.37 (2H, q, J=7.0), 2.49-1.80 (8H, m), 2.17 (6H, s), 1.27 (3H, t, J=7.0), 1.16 (3H, t, J=7.0)。

物性：ガム状。

(実施例 581)

シクロプロパンカルボキシリックアシッド=8, 8-エチレンジオキシー-3-(2, 6-ジメチルフェニル)-1-ヒドロキシー-1-アザスピロ[4, 5]デカノン-3-エン-2-オン-4-イル=エステル (化合物番号 11-79)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$   $\delta$  (ppm): 10.66 (1H, brd. s), 7.15-6.99 (3H, m), 3.95 (4H, s), 2.35-1.51 (8H, m), 2.04 (6H, s), 0.88-0.68 (4H, m)。

物性: 結晶 (融点: 180-182°C)。

以下の製剤例において、化合物及び補助剤の種類及び配合比率はこれらのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。また、以下の説明において、%は質量百分率を示す。

#### (製剤例 1)

##### 乳剤

化合物番号 1-5 の化合物 5% に、キシレン 42.5% 及びジメチルスルホキシド 42.5% を加え溶解し、次いでこれにポリオキシエチレンヒマシ油エーテルとアルキルベンゼンスルホン酸カルシウムの混合物 (8:2) 10% を混合して乳剤とした。本剤は水で希釈し、散布液として使用する。

#### (製剤例 2)

##### 水和剤

化合物番号 1-5 の化合物 5% にカオリン 79% 及び珪藻土 10% を混合し、更にラウリル硫酸ナトリウム 3% 及びリグニンスルホン酸ナトリウム 3% を混合して微粉碎して水和剤を得た。本剤は水で希釈して散布液として使用する。

#### (製剤例 3)

##### 粉剤

化合物番号 1-5 の化合物 1% にタルクと炭酸カルシウムの混合物 (1:1) 99% を加え、混合後、粉碎して粉剤とした。本剤はこのまま散布して使用する。

(製剤例 4)粒剤

化合物番号 1-5 の化合物 2% をベントナイト微粉末 30%、タルク 66%、リグニンスルホン酸ナトリウム 2% と混合した後、水を加えて均等になるまで混練する。次に造粒機を通して造粒し整粒機、乾燥機、篩を通すことにより粒径 0.6 ~ 1.0 mm の粒剤とした。本剤はこのまま土壌面に散布して使用する。

(製剤例 5)油剤

化合物番号 1-5 の化合物 0.1% を白灯油に溶解し、全体を 100% とし油剤を得た。

(試験例 1)コナガ殺虫試験

本発明化合物の 5% 乳剤を製剤例 1 に準じて調製し、有効成分が 200 ppm となるよう、水で希釈した {展着剤として新グラミン (登録商標、三共株式会社製) を 2000 倍希釈になるように添加した。}。キャベツの葉をこの薬液に 20 秒間浸漬し、風乾後、250 ml 入りのプラスチックカップに入れた。これに、コナガ 3 令幼虫を 10 頭放飼し、25℃、16 時間 : 明、8 時間 : 暗の恒温室に置いた。処理 5 日後に、死虫数を調査し、死虫率を算出した。

その結果、化合物番号 1-13、1-19、1-22、1-24、1-26、1-27、1-28、1-33、1-35、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-49、1-51、1-54、1-57、1-59、1-71、1-74、1-75、1-76、1-78、1-83、1-84、1-86、1-87、1-88、1-90、1-99、1-105、1-111、1-112、1-123、1-128、1-130、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-143、1-144、1-146、1-147、1-148、1-152、1-154、1-158、1-167、1-168、1-169、1-192、2-3、2-5、2-6、2-8、2-9、2-11、2-12、

2-18、2-19、2-20、2-22、2-23、2-24、2-25、2-26、5-16、5-39、5-67、5-68、5-70、5-79、5-99、5-101、5-104、5-105、5-106、5-108、5-109、5-112、6-4、6-12、6-16、6-20及び6-30の化合物が、死虫率100%を示した。

### (試験例2)

#### トビイロウンカ殺虫試験

本発明化合物の5%乳剤を製剤例1に準じて調製し、有効成分が10ppmになるよう水で希釈した〔展着剤として新グラミン（登録商標、三共株式会社製）を2000倍希釈になるように添加した。〕。イネ幼苗を円筒内に入れ、根部を薬液に浸漬し、トビイロウンカ3令幼虫を10頭放飼した。この時、スポンジで供試虫と薬液とが直接、触れないようにした。蓋をして25℃、16時間：明、8時間：暗の条件下で放置した。5日後に、虫の状態を観察し、死虫率を求めた。

その結果、化合物番号1-5、1-6、1-13、1-17、1-19、1-22、1-24、1-26、1-27、1-28、1-33、1-35、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-49、1-51、1-53、1-54、1-57、1-71、1-72、1-74、1-75、1-76、1-78、1-79、1-83、1-84、1-86、1-87、1-88、1-90、1-91、1-95、1-99、1-105、1-106、1-111、1-112、1-123、1-128、1-130、1-134、1-137、1-139、1-143、1-144、1-146、1-147、1-148、1-154、1-169、1-275、2-2、2-3、2-5、2-8、2-9、2-24、2-25、2-26、2-34、2-66、2-114、2-178、2-194、2-371、5-1、5-16、5-39、5-67、5-68、5-70、5-79、5-93、5-99、5-101、5-104、5-105、5-106、5-108、5-109、5-110、5-164、5-172、5-176、5-184、6-12、6-30及び7-22の化合物が、死虫率85%以上を示した。

(試験例3)ツマグロヨコバイ殺虫試験

本発明化合物の5%乳剤を製剤例1に準じて調製し、有効成分が10ppmになるよう水で希釈した〔展着剤として新グラミン（登録商標、三共株式会社製）を2000倍希釈になるように添加した。〕。イネ幼苗を円筒内に入れ、根部を薬液に浸漬し、ツマグロヨコバイ3令幼虫を10頭放飼した。この時、スポンジで供試虫と薬液とが直接、触れないようにした。蓋をして25℃、16時間：明、8時間：暗の条件下で放置した。5日後に、虫の状態を観察し、死虫率を求めた。

その結果、化合物番号1-5、1-6、1-13、1-17、1-19、1-22、1-24、1-26、1-27、1-28、1-33、1-35、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-49、1-51、1-53、1-54、1-57、1-71、1-72、1-74、1-75、1-76、1-78、1-79、1-83、1-84、1-86、1-87、1-88、1-90、1-91、1-99、1-105、1-106、1-111、1-112、1-123、1-128、1-130、1-134、1-137、1-139、1-143、1-144、1-146、1-148、1-154、1-169、2-2、2-3、2-5、2-8、2-9、2-24、2-25、2-26、2-34、2-66、2-114、2-178、2-194、2-371、5-1、5-16、5-39、5-67、5-68、5-70、5-79、5-93、5-99、5-101、5-104、5-105、5-106、5-108、5-109、5-110、5-164、5-172、5-176、6-12、6-30及び7-22の化合物が、死虫率85%以上を示した。

(試験例4)ワタアブラムシ殺虫試験

水で湿らせた脱脂綿の上にキュウリ葉リーフディスク（4.5cm×4.5cm）を乗せ、ワタアブラムシ成虫を放飼した。18時間産仔させた後成虫を除去し、仔虫数をリーフディスク当り10頭となるよう調整した。本発明化合物の5%乳剤を製剤例1に準じて調製し、有効成分が200ppmとなるよう水で希釈し〔展着剤



として新グラミン（登録商標、三共株式会社製）を2000倍希釈になるように添加した。}、この薬液2mlを回転式散布塔を用いて該リーフディスクに散布した。風乾後、リーフディスクをシール容器に入れ、25℃、16時間：明、8時間：暗の恒温室に置いた。処理5日後に死虫数を調査し、死虫率を算出した。

その結果、化合物番号1-13、1-19、1-22、1-24、1-26、1-33、1-35、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-49、1-51、1-54、1-71、1-74、1-75、1-76、1-78、1-83、1-84、1-86、1-87、1-88、1-90、1-91、1-92、1-99、1-105、1-111、1-112、1-123、1-128、1-130、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-143、1-144、1-146、1-147、1-148、1-151、1-152、1-154、1-155、1-156、1-158、1-159、1-160、1-166、1-167、1-168、1-169、1-171、1-192、2-3、2-5、2-6、2-8、2-9、2-11、2-12、2-19、2-20、2-22、2-23、2-24、2-25、2-26、2-34、2-66、2-178、2-194、2-371、5-16、5-39、5-67、5-68、5-70、5-79、5-93、5-99、5-101、5-104、5-105、5-108、5-109、5-188、6-12、6-16及び6-30の化合物が、死虫率100%を示した。

#### (試験例5)

##### ワタアブラムシ殺虫試験

水で湿らせた脱脂綿の上にキュウリ葉リーフディスク(4.5cm×4.5cm)を乗せ、ワタアブラムシ成虫を放飼した。18時間産仔させた後成虫を除去し、仔虫数をリーフディスク当り10頭となるよう調整した。本発明化合物の5%乳剤を製剤例1に準じて調製し、有効成分が12.5ppmとなるよう水で希釈し{展着剤として新グラミン（登録商標、三共株式会社製）を2000倍希釈になるように添加した。}、この薬液2mlを回転式散布塔を用いて該リーフディスクに散布した。風乾後、リーフディスクをシール容器に入れ、25℃、16時間：明、8時間：

暗の恒温室に置いた。処理5日後に死虫数を調査し、死虫率を算出した。

なお、比較として、特開平4-226957号公報の実施例No. 7の化合物(比較化合物a)及び同公報実施例No. 33(比較化合物b)を用いた。

比較化合物a: 4-ヒドロキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1, 5-ジヒドロピロール

比較化合物b: 4-ヒドロキシ-5, 5-ジメチル-2-オキソ-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-1, 5-ジヒドロピロール

その結果、比較化合物a及びbの死虫率が0であったが、本発明の化合物番号1-99及び2-8の化合物の死虫率はいずれも90%であった。

#### (試験例6)

##### コナガ殺虫試験

比較として、特開平4-226957号公報の実施例No. 7の化合物(比較化合物a)について、以下の試験を行なった。

本発明化合物の5%乳剤を製剤例1に準じて調製し、有効成分が12.5ppmとなるよう、水で希釈した。{展着剤として新グラミン(登録商標、三共株式会社製)を2000倍希釈になるように添加した。}。キャベツの葉をこの薬液に20秒間浸漬し、風乾後、250ml入りのプラスチックカップに入れた。これに、コナガ3令幼虫を10頭放飼し、25℃、16時間:明、8時間:暗の恒温室に置いた。処理5日後に、死虫数を調査し、死虫率を算出した。

なお、比較として、試験例5記載の比較化合物aを用いた。

その結果、比較化合物aの死虫率が0であったが、本発明の化合物番号1-99の化合物の死虫率は100%であった。

#### (試験例7)

##### ナミハダニ殺ダニ試験

ササゲのリーフディスクにナミハダニ成虫4頭を放飼し、その翌日、成虫を取り除いた。1週間後に、本発明化合物の5%乳剤を製剤例1に準じて調製し、有効成分が200ppmとなるよう水で希釈し{展着剤として新グラミン(登録商標、三

共株式会社製)を2000倍希釈になるように添加した。}、この薬液2mlを、回転式散布塔を用いて該リーフディスクに散布した。風乾後、25℃、16時間：明、8時間：暗の条件下で放置した。5日後に生存ダニ数を調査し、5頭以下の化合物を有効とした(本発明化合物を散布しない場合、調査時のダニ数は大幅に増加する。))。

その結果、化合物番号1-13、1-17、1-19、1-27、1-28、1-33、1-35、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-49、1-51、1-53、1-54、1-71、1-72、1-75、1-79、1-83、1-84、1-87、1-99、1-105、1-106、1-111、1-112、1-123、1-128、1-130、1-134、1-136、1-137、1-139、1-143、1-144、1-146、1-148、1-169、1-275、2-3、2-6、2-9、2-19、2-20、2-22、2-23、2-25、2-34、2-66、2-178、5-1、5-16、5-39、5-67、5-70、5-79、5-93、5-99、5-101、5-104、5-105、5-106、5-108、5-109、5-110、5-111、5-112、5-164、6-4、6-12、6-16、6-20及び6-30の化合物が、有効と判定された。

#### (試験例8)

##### 水田雑草発芽前処理

100cm<sup>2</sup>ポットに水田土壌を充填し、休眠覚醒したタイヌビエの種子を表層1cmに混和した。また、2葉期の水稻の苗を移植して湛水状態とし、温室で生育させた。3日後に、製剤例1に準じて調整した水和剤を用いて、20g/aとなる薬量を湛水土壌処理し、21日後に生育抑制度を調査した。

その結果、化合物番号1-6、1-13、1-17、1-28、1-42、1-71、1-75、1-79、1-83、1-84、1-86、1-87、1-99、1-106、1-111、1-112、1-130、1-143、1-144、1-146、1-155、2-11、2-178、5-1、5-16、5-67、5-68、5-70、5-79、5-99、5-101、5-104、5-105、

5-106、5-108、5-109、5-110、6-10、6-12、6-16、6-20及び7-22の化合物が、生育抑制率100%を示した。

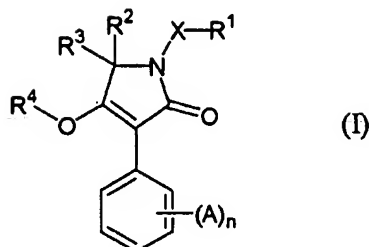
〔産業上の利用可能性〕

本発明のN-置換ジヒドロピロール誘導体は、例えば、半翅目害虫、鱗翅目害虫、鞘翅目害虫、双翅目害虫、膜翅目害虫、直翅目害虫、シロアリ目害虫、アザミウマ目害虫、ハダニ類及び植物寄生性線虫等の広範囲の害虫に対して優れた防除効果を示す。

また、本発明のN-置換ジヒドロピロール誘導体は、優れた除草活性を有する。

## 請求の範囲

## 1. 下記一般式



[式中、R<sup>1</sup>は、水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基《当該アルキル基は、1個のC<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）、1個のC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルオキシ基、1個の（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ）C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、1乃至3個のハロゲン原子、1個のシアノ基、1個のジ（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。》、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル基、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）により置換されてよい。）、C<sub>2</sub>～C<sub>10</sub>アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルコキ

シカルボニル基、ジ ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) カルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基 (当該フェニルスルホニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。) を表し、

$R^2$ 及び $R^3$ は、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基 (当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。))、1又は2個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の ( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1乃至13個のハロゲン原子又は1個の5若しくは6員複素環基 (当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。) により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基 (当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、フェニル基 (当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。) 又は5若しくは6員複素環基 (当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。) からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。) を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環 (当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の ( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個のジ ( $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ基又は1個のN- ( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^6$ で表される基 (式中、 $R^6$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。) により中断されていてよい。) を表し、

$R^4$ は、水素原子、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基 (当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個の $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、 $C_4$

～C<sub>7</sub>シクロアルキルカルボニル基（当該シクロアルキルカルボニル基は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基及びハロゲン原子からなる群から選ばれる1乃至4個の置換基、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1又は2個のシアノ基又は1個のフェニル基（当該フェニル基は、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルケニルカルボニル基（当該アルケニルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基、1乃至3個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のC<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルキルカルボニルオキシ基、1個のC<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシカルボニル基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。）、4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1乃至3個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、1乃至3個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基又は1個のハロゲン原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。）、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシカルボニル基（当該アルコキシカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルケニルオキシカルボニル基、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルキニルオキシカルボニル基、（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ）カルボニル基、（フェニルチオ）カルボニル基（当該（フェニルチオ）カルボニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ）チオカルボニル基、（フェノキシ）チ

オカルボニル基（当該（フェノキシ）チオカルボニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_7$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基（当該フェニルジチオカルボニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ） $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基（当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又は $C_2 \sim C_7$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又はジ（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ）チオホスホリル基を表し、

Aは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至13個のハロゲン原子により置換されてよい。）、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基から



なる群から選ばれる 1 又は 2 個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基（当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び  $C_1 \sim C_6$  アルキル基からなる群から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基により置換されてよい。）を表し、

$n$  は、1 ～ 5 の整数を表し、

$X$  は、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。]

で表される  $N$ －置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

2.  $R^1$  が、水素原子、 $C_1 \sim C_4$  アルキル基《当該アルキル基は、1 個の  $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル基、1 個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び  $C_1 \sim C_4$  アルキル基からなる群から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基により置換されてよい。）、1 又は 2 個の  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1 乃至 5 個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、1 個の  $C_3 \sim C_5$  アルケニルオキシ基、1 個の ( $C_1 \sim C_4$  アルコキシ)  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ基、1 個のベンジルオキシ基、1 個の  $C_1 \sim C_4$  アルキルチオ基、1 乃至 3 個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1 個のシアノ基、1 個のジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) アミノ基又は 1 個の 5 若しくは 6 員複素環基 {当該複素環基は、1 乃至 3 個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び  $C_1 \sim C_4$  アルキル基（当該アルキル基は、1 乃至 3 個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる 1 又は 2 個の置換基により置換されてよい。} により置換されてよい。》、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$  アルケニル基（当該アルケニル基は、1 乃至 3 個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$  アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び  $C_1 \sim C_4$  アルキル基からなる群から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基により置換されてよい。）、5 若しくは 6 員複素環基 {当該複素環基は、1 乃至 3 個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1 個の  $C_1 \sim C_4$  アルキル基（当該アルキル基は、1 乃至 3 個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）により置換されてよい。}、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1 乃至 3 個の塩素原子、

フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。)、ベンゾイル基(当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_5$ アルコシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基(当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。))である、請求の範囲第1項に記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

3.  $R^1$ が、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、1個のフェニル基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、1個の( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個のシアノ基又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)}により置換されてよい。}、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、 $C_2 \sim C_4$ アルコシカルボニル基、ジ( $C_1 \sim C_3$ アルキル)カルバモイル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基である、請求の範囲第1項に記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

4.  $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基{当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_2$ アルコキシ) $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基又は1個の $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ基により置換されてよい。}である、請求の範囲第1項に記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

5.  $R^1$ が、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基により置換されてよい。）である、請求の範囲第1項に記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

6.  $R^2$ 及び $R^3$ が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又は5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環（当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノ基、1個のメチレンジオキシ基、1個のエチレンジオキシ基、1個のトリメチレンジオキシ基又は1個のN-（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ）イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^{6a}$ で表される基（式中、 $R^{6a}$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。）である、請求の範囲第1項乃至第

5 項のいずれか 1 つに記載の N-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

7.  $R^2$  及び  $R^3$  が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_3$  アルキル基 { 当該アルキル基は、1 個の  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル基、1 個のフェニル基 ( 当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、 $C_1 \sim C_3$  アルキル基及び  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ基からなる群から選ばれる 1 又は 2 個の置換基により置換されてよい。 ) 、1 又は 2 個の  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ基、1 個の (  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ )  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ基、1 乃至 3 個の塩素原子若しくはフッ素原子又は 1 個の 5 若しくは 6 員複素環基 ( 当該複素環基は、1 又は 2 個の酸素原子又は窒素原子を含有する。 ) により置換されてよい。 } 、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_4$  アルケニル基、 $C_3 \sim C_4$  アルキニル基、フェニル基 ( 当該フェニル基は、1 又は 2 個の  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ基により置換されてよい。 ) 又は 5 若しくは 6 員複素環基 ( 当該複素環基は、1 又は 2 個の酸素原子又は窒素原子を含有する。 ) を表し、又は、 $R^2$  及び  $R^3$  は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、4 乃至 6 員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環 { 当該環は、1 又は 2 個の  $C_1 \sim C_3$  アルキル基、1 個の  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ基、1 個の (  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ )  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ基、1 個のジ (  $C_1 \sim C_3$  アルキル ) アミノ基、1 個のエチレンジオキシ基、1 個のトリメチレンジオキシ基又は 1 個の N- (  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ ) イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式  $NR^{6b}$  で表される基 ( 式中、 $R^{6b}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキル基を表す。 ) により中断されていてよい。 } である、請求の範囲第 1 項乃至第 5 項のいずれか 1 つに記載の N-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

8.  $R^2$  及び  $R^3$  が、同一又は異なって、 $C_1 \sim C_2$  アルキル基を表し、又は、 $R^2$  及び  $R^3$  は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロヘキサン環 { 当該シクロヘキサン環は、1 又は 2 個の  $C_1 \sim C_2$  アルキル基、1 個の  $C_1 \sim C_2$  アルコキシ基、1 個の (  $C_1 \sim C_2$  アルコキシ )  $C_1 \sim C_2$  アルコキシ基、1 個のエチレンジオキシ基、1 個のトリメチレンジオキシ基又は 1 個の N- (  $C_1 \sim C_2$  アルコキシ ) イミノ基により置換されてよい。 } である、請求の範囲第 1 項乃至第 5 項のいずれ

か1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

9.  $R^2$ 及び $R^3$ が、共に、メチル基を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロヘキサン環（当該シクロヘキサン環は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基又は $N-(C_1 \sim C_2 \text{アルコキシ})$ イミノ基により置換されてよい。）である、請求の範囲第1項乃至第5項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

10.  $R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基（当該シクロアルキルカルボニル基は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、塩素原子、フッ素原子及び臭素原子からなる群から選ばれる1乃至4個の置換基、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1又は2個のシアノ基又は1個のフェニル基（当該フェニル基は、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルカルボニル基（当該アルケニルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基、1乃至3個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_2 \sim C_5$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。）、4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1又は2個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。）、1又

は2個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基又は1個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。}、 $C_2 \sim C_8$ アルコシカルボニル基（当該アルコシカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子若しくは臭素原子、1個の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。}、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルコシカルボニル基、 $C_4 \sim C_7$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_4 \sim C_7$ アルキニルオキシカルボニル基、（ $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ）カルボニル基、（フェニルチオ）カルボニル基（当該（フェニルチオ）カルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。}、（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ）チオカルボニル基、（フェノキシ）チオカルボニル基（当該（フェノキシ）チオカルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。}、 $C_2 \sim C_8$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基（当該フェニルジチオカルボニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。}、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基（当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。}、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ） $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基（当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。}）又は $C_2 \sim C_5$ アルコシカルボニル基により置換されてよい。}、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル基、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル基、ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキ

ル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。）又はジ（ $C_1 \sim C_4$ アルコキシ）チオホスホリル基である、請求の範囲第1項乃至第9項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

11.  $R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルカルボニル基（当該シクロアルキルカルボニル基は、1乃至4個の $C_1 \sim C_3$ アルキル基、塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個のシアノ基又は1個のフェニル基（当該フェニル基は、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルカルボニル基（当該アルケニルカルボニル基は、1又は2個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、塩素原子、フッ素原子及び $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基、1個の $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、1個のフェノキシ基、1個のシアノ基又は1個のニトロ基により置換されてよい。）、4乃至6員複素環カルボニル基（当該複素環カルボニル基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒

素原子を含有し、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基又は1個の塩素原子若しくはフッ素原子により置換されてよく、ベンゼン環と縮合してもよい。）、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基（当該アルコキシカルボニル基は、1乃至3個の塩素原子若しくはフッ素原子、1個の $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、1個の $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、1個のフェニル基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_6 \sim C_7$ シクロアルコキシカルボニル基、 $C_4 \sim C_6$ アルケニルオキシカルボニル基、 $C_4 \sim C_6$ アルキニルオキシカルボニル基、（ $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ）カルボニル基、（フェニルチオ）カルボニル基、（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ）チオカルボニル基、（フェノキシ）チオカルボニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキルジチオカルボニル基、フェニルジチオカルボニル基、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の、フェニル基、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ） $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、シアノ基、フェノキシ基又は $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル基、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル基、ジ（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）カルバモイル基（当該ジアルキルカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、ジ（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）チオカルバモイル基（当該ジアルキルチオカルバモイル中の2つのアルキル基は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって5若しくは6員複素環（当該複素環は、1個の窒素原子の他に1個の酸素原子又は窒素原子を含有してよい。）を形成してよい。）、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基又はジ（ $C_1 \sim C_3$ アルコキシ）チオホスホリル基である、請求の範囲第1項乃至第9項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

12.  $R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基（当該シクロプロピルカルボニル基は、1個の $C_1 \sim C_2$ アルキル基により置



換されてよい。)、 $C_3 \sim C_4$ アルケニルカルボニル基、ベンゾイル基又は $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基である、請求の範囲第1項乃至第9項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

13.  $R^4$ が、水素原子、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基(当該シクロプロピルカルボニル基は、1個のメチル基により置換されてよい。 ) 又は $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル基である、請求の範囲第1項乃至第9項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

14. Aが、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至5個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至3個の塩素原子、フッ素原子又は臭素原子により置換されてよい。)、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル基、フェニル基(当該フェニル基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。)、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至3個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基(当該フェノキシ基は、塩素原子、フッ素原子、臭素原子及び $C_1 \sim C_4$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至3個の置換基により置換されてよい。 ) である、請求の範囲第1項乃至第13項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

15. Aが、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個の塩素原子又はフッ素原子により置換されてよい。)、塩素原子、フッ素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル基、フェニル基、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1又は2個の酸素原子又は窒素原子を含有する。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基である、請求の範囲第1項乃至第13項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロー

ル誘導体又はその塩。

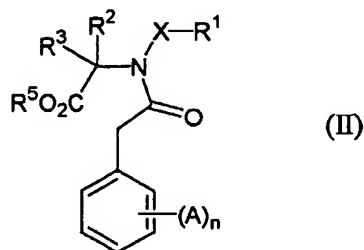
16. Aが、メチル基又は塩素原子である、請求の範囲第1項乃至第13項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

17. nが、2又は3である、請求の範囲第1項乃至第16項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

18. Xが、酸素原子である、請求の範囲第1項乃至第17項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

19. Xが、硫黄原子である、請求の範囲第1項乃至第17項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体又はその塩。

20. 下記一般式



〔式中、R¹は、水素原子、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基〔当該アルキル基は、1個のC<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）〕、1又は2個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）〕、1個のC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニルオキシ基、1個の（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ）C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオ基、1乃至3個のハロゲン原子、1個のシアノ基、1個のジ（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基〔当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子

及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。}により置換されてよい。》、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）カルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）を表し、

$R^2$ 及び $R^3$ は、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ） $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1乃至13個のハロゲン原子又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。）により置換されてよい。）、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）又は5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子

を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環（当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ） $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ基又は1個のN-（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ）イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^6$ で表される基（式中、 $R^6$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。）により中断されていてよい。）を表し、

Aは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至13個のハロゲン原子により置換されてよい。）、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基（当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）を表し、

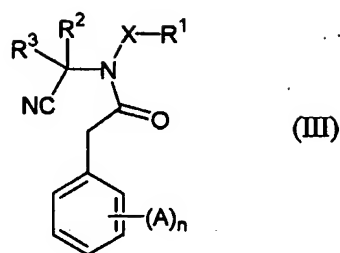
$n$ は、1～5の整数を表し、

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、

$R^5$ は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。]

で表されるN-置換アミド化合物。

## 21. 下記一般式



[式中、 $R^1$ は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基《当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、1又は2個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基（当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。）、1個の $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基、1個の（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ） $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個のベンジルオキシ基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、1乃至3個のハロゲン原子、1個のシアノ基、1個のジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基又は1個の5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。）により置換されてよい。》、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基（当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、フェニル基（当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、5若しくは6員複素環基（当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、1個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基（当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。）により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキルカルボニル基（当該アルキルカルボニル基は、1乃至3個のハロゲン原子、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は1個のフェノキシ基により置換されてよい。）、ベンゾイル基（当該ベンゾイル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。）、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル基、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）カルバモイル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基又はフェニルスルホニル基（当該フェニルスルホニル基は、ハロゲン原子

及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)を表し、

$R^2$ 及び $R^3$ は、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1個の $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、1個のフェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)、1又は2個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1乃至13個のハロゲン原子又は1個の5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有する。))により置換されてよい。)、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基(当該アルケニル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、フェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)又は5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至3個のハロゲン原子により置換されてよい。)からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。))を表し、又は、 $R^2$ 及び $R^3$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に、4乃至7員の、シクロアルカン、シクロアルケン若しくはシクロアルカンジエン環(当該環は、1乃至3個の $C_1 \sim C_6$ アルキル基、1個の $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個の( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、1個のジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ基、1個の $C_1 \sim C_4$ アルキレンジオキシ基又は1個のN-( $C_1 \sim C_6$ アルコキシ)イミノ基により置換されてよく、任意の位置で環が酸素原子、硫黄原子又は式 $NR^6$ で表される基(式中、 $R^6$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表す。))により中断されていてよい。)を表し、

Aは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基(当該アルキル基は、1乃至13個のハロゲン原子により置換されてよい。)、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基(当該アルコキシ基は、1乃至5個のハロゲン原子により置換されてよい。)、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、フェニル基(当該フェニル基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置

換されてよい。)、5若しくは6員複素環基(当該複素環基は、1乃至4個の酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を含有し、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1又は2個の置換基により置換されてよい。)、シアノ基、ニトロ基、アミノ基又はフェノキシ基(当該フェノキシ基は、ハロゲン原子及び $C_1 \sim C_6$ アルキル基からなる群から選ばれる1乃至5個の置換基により置換されてよい。)を表し、

nは、1～5の整数を表し、

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。]

で表されるN-置換アミド化合物。

22. 請求の範囲第1項乃至第19項のいずれか1つに記載のN-置換ジヒドロピロール誘導体を有効成分として含有する農薬。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/02848

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.<sup>7</sup> C07D207/46, C07D209/54, C07D213/30, C07D307/12,  
C07D309/08, C07D317/34, C07D401/12, C07D405/12, C07D471/  
10, C07D491/107, C07D495/10, A01N43/36, C07C259/06

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.<sup>7</sup> C07D207/46, C07D209/54, C07D213/30, C07D307/12,  
C07D309/08, C07D317/34, C07D401/12, C07D405/12, C07D471/  
10, C07D491/107, C07D495/10, A01N43/36, C07C259/06

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
REGISTRY (STN) , CA (STN) , CAOLD (STN) , CAPLUS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X         | Ambartsumyan, E. N. et al., "Synthesis of new derivatives of arenesulfonamides and arenesulfohydrazides", Arm. Khim. Zh. (1991), 44(2), 117-23  | 20                    |
| A         | US, 5045560, A (Bayer Aktiengesellschaft), 03 September, 1991 (03.09.91)<br>& JP, H02-225459, A & EP, 377893, A2<br>& AU, 4764990, A & DE, 58907411, C<br>& BR, 9000040, A & ZA, 9000074, A | 1-22                  |

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

## \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  
"E" earlier document but published on or after the international filing date  
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention  
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone  
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art  
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
11 July, 2000 (11.07.00)

Date of mailing of the international search report  
25 July, 2000 (25.07.00)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.



## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D207/46, C07D209/54, C07D213/30, C07D307/12, C07D309/08, C07D317/34, C07D401/12, C07D405/12, C07D471/10, C07D491/107, C07D495/10, A01N43/36, C07C259/06

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D207/46, C07D209/54, C07D213/30, C07D307/12, C07D309/08, C07D317/34, C07D401/12, C07D405/12, C07D471/10, C07D491/107, C07D495/10, A01N43/36, C07C259/06

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の<br>カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示   | 関連する<br>請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| X               | Ambartsumyan, E. N. et al., "Synthesis of new derivatives of arenesulfonamides and arenesulfohydrazides", Arm. Khim. Zh. (1991), 44(2), 117-23                    | 20               |
| A               | US, 5045560, A (Bayer Aktiengesellschaft) 3.9月.1991(03.09.91) &JP, H02-225459, A &EP, 377893, A2 &AU, 4764990, A &DE, 58907411, C &BR, 9000040, A &ZA, 9000074, A | 1-22             |

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

11.07.00

国際調査報告の発送日

25.07.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

榎本 佳子

4 P 9638

電話番号 03-3581-1101 内線 3492